



(19) RU⁽¹¹⁾ 2 125 053⁽¹³⁾ C1

(51) МПК⁶ C 07 D 417/14, 417/06, 413/14,
A 61 K 31/425, 31/42

РОССИЙСКОЕ АГЕНТСТВО
ПО ПАТЕНТАМ И ТОВАРНЫМ ЗНАКАМ

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ПАТЕНТУ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

(21), (22) Заявка: 96119770/04, 27.03.1995

(30) Приоритет: 28.03.1994 JP 6/57192
29.11.1994 JP 6/295177

(46) Дата публикации: 20.01.1999

(56) Ссылки: SU 1099843 A, 1984. EP 332331 A2,
1989. EP 332332 A1, 1989. WO 89/086650 A1,
1989.

(85) Дата перевода заявки РСТ на национальную
фазу: 27.09.96

(86) Заявка РСТ:
JP 95/00560 (27.03.95)

(87) Публикация РСТ:
WO 95/26347 (05.10.95)

(98) Адрес для переписки:
103735 Москва, ул.Ильинка 5/2, Союзпатент

(71) Заявитель:
Ниссан Кемикал Индастриз Лтд. (JP)

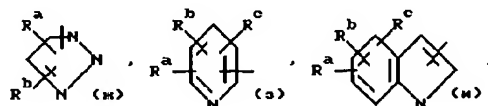
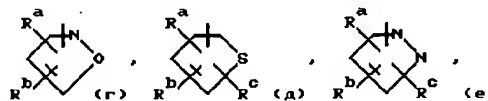
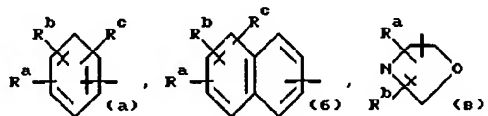
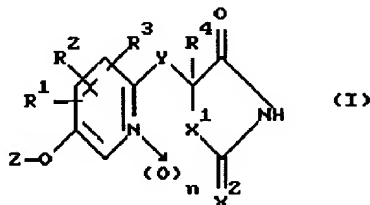
(72) Изобретатель: Есио Охара (JP),
Микио Сузуки (JP), Нобухиде Мияти
(JP), Катсухиро Като (JP), Кеисуке Охдои
(JP), Тетсуя Кобаяси (JP), Кен-ити Сикада
(JP), Такеси Наито (JP), Такаси Етсумото (JP)

(73) Патентообладатель:
Ниссан Кемикал Индастриз Лтд. (JP)

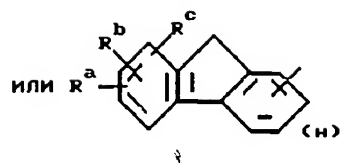
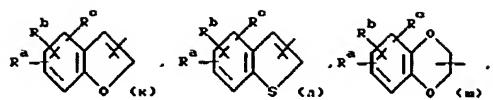
(54) СОЕДИНЕНИЕ ТИАЗОЛИДИНА ПИРИДИНОВОГО ТИПА ИЛИ ЕГО СОЛЬ, ГИПОГЛИКЕМИЧЕСКОЕ СРЕДСТВО, АНТИГЛИКАЦИОННОЕ СРЕДСТВО И ФАРМАЦЕВТИЧЕСКОЕ СРЕДСТВО, ИНГИБИРУЮЩЕЕ ГИПЕРГЛИКЕМИЮ, НЕФЕРМЕНТАТИВНУЮ ГЛИКАЦИЮ И АЛЬДОЗОРЕДУКТАЗУ, ДЛЯ ПРЕДУПРЕЖДЕНИЯ И ЛЕЧЕНИЯ САХАРНОГО ДИАБЕТА И ДИАБЕТИЧЕСКИХ ОСЛОЖНЕНИЙ

(57) Реферат:

Соединение тиазолидина пиридинового типа и его соль формулы I, где X¹ - S; X² - S или O; Y - CR⁶R⁷, R⁶ и R⁷ - атом водорода, или R⁷ вместе с R⁴ образуют связь; Z - C₁₋₁₀-алкил, замещенную силильную группу; или - A - B (A - двухвалентная C₁₋₆-насыщенную или C₂₋₆-ненасыщенную углеводородную группу, возможно замещенную самое большее 3 гидроксильными, оксо- и C₁₋₇-алкилами, и B представляет собой радикал формулы (a-n), при этом каждый R^a и R^b - атом водорода, алкил, галоген, фенил, α-нафтил, β-нафтил, фурил, и R^c - атом водорода или C₁₋₇-алкил, R¹, R² и R³ каждый представляет водород; n = 0. Соединение I или их фармацевтически приемлемые соли обладают гипогликемической активностью и могут использоваться для предупреждения или лечения сахарного диабета у млекопитающих. Кроме того, соединения I обладают антигликационной активностью и пригодны для лечения диабетических осложнений. 4 с. и 5 з.п. ф-лы, 28 табл.



RU 2125053 C1



RU 2125053 C1



RUSSIAN AGENCY
FOR PATENTS AND TRADEMARKS

(19) **RU** ⁽¹¹⁾ **2 125 053** ⁽¹³⁾ **C1**
(51) Int. Cl.⁶ **C 07 D 417/14, 417/06,**
413/14, A 61 K 31/425, 31/42

(12) **ABSTRACT OF INVENTION**

(21), (22) Application: 96119770/04, 27.03.1995

(30) Priority: 28.03.1994 JP 6/57192
29.11.1994 JP 6/295177

(46) Date of publication: 20.01.1999

(85) Commencement of national phase: 27.09.96

(86) PCT application:
JP 95/00560 (27.03.95)

(87) PCT publication:
WO 95/26347 (05.10.95)

(98) Mail address:
103735 Moskva, ul. Il'inka 5/2, Sojuzpatent

(71) Applicant:
Nissan Kemikal Indastriz Ltd. (JP)

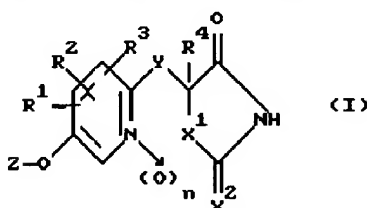
(72) Inventor: Esio Okhara (JP),
Mikio Suzuki (JP), Nobukhide Mijati
(JP), Katsukhiro Kato (JP), Keisuke Okhdoi
(JP), Tetsuja Kobajasi (JP), Ken-iti Sikada
(JP), Takesi Naito (JP), Takasi Etsumoto (JP)

(73) Proprietor:
Nissan Kemikal Indastriz Ltd. (JP)

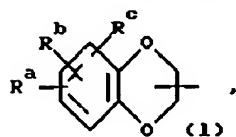
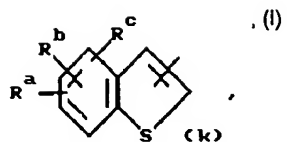
(54) COMPOUND OF THIAZOLIDINE OF PYRIDINE TYPE OR ITS SALT, HYPOGLYCAEMIC AGENT, ANTIGLYCATING AGENT AND PHARMACEUTICAL AGENT INHIBITING HYPERGLYCAEMIA, NONENZYMATIC GLYCATION AND ALDOSREDUCTASE FOR PROPHYLAXIS AND TREATMENT OF DIABETES MELLITUS AND DIABETIC COMPLICATIONS

(57) Abstract:

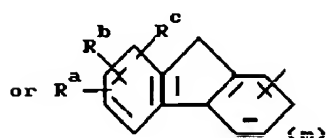
FIELD: organic chemistry, medicine.
SUBSTANCE: invention relates to compound of thiazolidine of pyridine type and its salt of the formula (I)



RU 2125053 C1



and (m)



Each

R^a and R^b - hydrogen atom, alkyl, halogen, phenyl, α -naphthyl, β -naphthyl, furyl, and R^c - hydrogen atom or C_{1-7} -alkyl; R^1 , R^2 and R^3 each means hydrogen; $n = 0$. Compounds of the formula (l) or their pharmaceutically acceptable salts can be used for prophylaxis or treatment of diabetes mellitus in mammalian. Also, compounds (l) show antiglycation activity and useful for diabetic complications treatment. EFFECT: improved method of synthesis, enhanced effectiveness of compounds. 9 cl, 28 tbl, 15 ex

RU 2125053 C1

Настоящее изобретение относится к новым тиазолидинам пиридинового типа, обладающим гипогликемическим действием и антигликационным действием, которые являются полезными для медицины и ветеринарии, в частности пригодны для лечения или предупреждения сахарного диабета и диабетических осложнений.

До сих пор в качестве оральных гипогликемических средств для снижения содержания сахара в крови широко применяются различные производные сульфонилмочевины и производные бигуанидина. Однако, эти средства имеют недостатки, вызывая тяжелую гипогликемическую кому и появление молочного ацидоза, и, следовательно, при их практическом применении должны быть приняты все возможные меры предосторожности. "Chem. Pharm. Bull., vol. 30, p.3563 (1982)", "J. Med. Chem., vol. 32, p. 421 (1989)", "J. Med. Chem., vol. 34, p.318 (1991)", "J. Med. Chem., vol. 33, p.1418 (1990)", публикация не прошедшего экспертизу патента Японии N 64586/1980 и опубликованные описания европейских патентов N 177353, 283035, 283036, 332331, 332 332 и 605228 описывают различные тиазолидиндионы, которые дают гипогликемический эффект, и особенно пригодны для лечения диабета типа 11, и отмечается, что эти средства почти не вызывают таких гипогликемических симптомов, которые вызывают вышеупомянутые оральные гипогликемические средства. Однако, хотя такие соединения обладают функцией эффективно снижать содержание сахара в крови, но не доказано, что эти соединения действуют как снижающие или предупреждающие различные хронические симптомы, вызываемые диабетом, такие как диабетическая нефропатия, диабетическая катаракта, диабетическая ретинопатия, диабетическая невропатия и т.п.

С другой стороны, недавно отмечено, что неферментативное гликозилирование витальных белков вызывает различные заболевания, сопровождаемые диабетом и атеросклерозом. Вообще, реакция редуцирующих сахаров с аминокислотами и белками, вызываемая тепловой обработкой пищи или при хранении пищи, известна как реакция Мейллара (Maillard). В 1970-х выяснилось, что реакция Мейллара фактически вызывается в живом организме, и в последнее время такая реакция называется гликацией (glycation) (см. "J. Biol. Chem., vol. 252, p. 2998 (1977)"). Кроме того, подтвердилось, что гликация усиливается при таких хронических гипергликемических состояниях как диабет и предполагается, что гликация запускает появление различных диабетических осложнений (см. New Eng. J. Med. vol. 314, p. 403 (1986)"). Процесс гликации до конца не ясен, но считается, что различные витальные белки взаимодействуют с редуцирующими сахарами с образованием - неферментативным - шиффовых оснований, и что после перегруппировки Амадори происходит структурирование и превращение во флуоресцентные чернеющие материалы, т.е., в AGE (конечные продукты увеличившегося гликозилирования). Выяснилось, что при диабетической катаракте

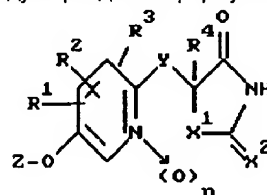
у крыс усиливается гликация белка хрусталика. Кроме того, предполагается, что гликация миелоновых белков вызывает диабетическую невропатию, и что гликация коллагена и эластина, присутствующих в соединительной ткани, вызывает почечную дисфункцию - индуцирование утолщения ренальной гломерулярной базальной мембраны и атеросклероз.

Brownlee et al. сообщили, что антигликационное действие аминогуанидина предотвращает образование белка AGE на стенках артерий у крыс, страдающих диабетом, и появляется возможность отметить аминогуанидин как средство для предупреждения заболеваний, в том числе, сахарного диабета (см. "Science vol. 232, p. 1629 (1986)"). Однако, вышеупомянутая функция аминогуанидина не всегда является достаточной и средство, достигающее антигликационного действия, удовлетворяющего требованиям практики, пока не найдено.

С другой стороны, известно, что альдозоредуктаза (AR) является ферментом для редуцирования альдоз, таких как глюкоза и галактоза, до полиолов, таких как сорбит и галактит, в живом организме. Также известно, что накопление в органах таким образом продуцированных ферментом полиолов индуцирует или усиливает различные диабетические осложнения, такие как диабетическую ретинопатию, диабетическую невропатию и диабетическую нефропатию, и, следовательно, ингибитор против такого фермента является пригодным в качестве средства для лечения этих диабетических осложнений.

При таком положении дел, авторы настоящего изобретения синтезировали различные тиазолидины, которые не описываются в вышеупомянутой литературе, и исследовали их свойства. В результате, авторы настоящего изобретения обнаружили соединение, обладающее антигликационным действием и активностью ингибирования альдозоредуктазы, которую не показывают вышеупомянутые известные соединения. Таким образом, настоящее изобретение относится к тиазолидинам пиридинового типа, способным предупреждать или лечить сахарный диабет и диабетические осложнения.

Новые производные тиазолидина пиридинового типа настоящего изобретения представляют собой тиазолидины пиридинового типа и их соли, изображаемые следующей далее формулой I



где X¹ представляет собой S или O;

X² представляет собой S, O или NH;

Y представляет собой

CR⁶/R⁶ представляет собой атом водорода, (C₁-C₇)-алкильную группу или (C₃-C₇)-циклоалкильную группу, и R⁷ представляет собой атом водорода, (C₁-C₇)-алкильную группу или

(C₃-C₇)-циклоалкильную группу, или образует вместе с R⁴ связь, или SO₂;

Z представляет собой (C₁-C₁₀)-алкильную группу, (C₂-C₁₀)-алкенильную группу, (C₂-C₁₀)-алкинильную группу, (C₃-C₇)-циклоалкильную группу, (C₃-C₇)-циклоалкенильную группу (каждая из упомянутых алкильных, алкенильных, алкинильных, циклоалкильных и циклоалкенильных групп может быть замещена самое большее 3 гидроксильными, оксо-, (C₁-C₇)-алкильными и (C₁-C₇)-алкоксигруппами/ фенильную группу, бифенильную группу, α- нафтильную группу, β- нафтильную группу, бензильную группу, пиридилную группу, пиримидинильную группу, пиридазинильную группу, фуранильную группу, тиенильную группу, пирролильную группу, пиразолильную группу, имидазолильную группу, пиранильную группу (каждая из вышеупомянутых фенильной, бифенильной, α- нафтильной, β- нафтильной, бензильной, пиридилной, пиримидинильной, пиридазинильной, фуранильной, тиенильной, пирролильной, пиразолильной, имидазолильной и пиранильной групп может быть замещена самое большее 3 гидроксильными, (C₁-C₇)-алкильными и (C₁-C₇)-алкоксильными группами и атомами галогена), замещенную силильную группу, (C₁-C₁₄)-алифатическую ацильную группу, (C₆-C₁₀)-ароматическую ацильную группу или -А-В (А представляет собой двухвалентную насыщенную (C₁-C₆)-или ненасыщенную (C₂-C₆)-углеводородную группу, которая может быть замещена самое большее 3 гидроксильными, оксо- и (C₁-C₇)-алкильными группами, и В представляет собой (C₃-C₁₀)-циклоалкильную, (C₃-C₇)-циклоалкенильную, (C₆-C₁₄)-ароматическую и (C₄-C₁₂)-гетероциклическую ароматическую группу, которые могут содержать самое большее 5 заместителей, в целом (упомянутая гетероциклическая ароматическая группа может содержать самое большее 5 гетероатомов, выбираемых из группы, состоящей из атома кислорода, атома серы и атома азота, как составные элементы гетероциклического ядра), или (C₄-C₆)-гетероциклоалифатическую группу (упомянутая гетероциклоалифатическая группа может содержать самое большее 3 гетероатома, выбираемых из группы, состоящей из атома кислорода, атома серы и атома азота, как составные элементы гетероциклического ядра));

каждый из R¹, R² и R³, независимо, представляет собой атом водорода, (C₁-C₇)-алкильную группу (которая может быть замещена гидроксильной группой), (C₃-C₇)-циклоалкильную группу, гидроксильную группу или атом галогена;

R⁴ представляет собой атом водорода или (C₁-C₇)-алкильную группу, или вместе с R⁷ образует связь; и

n равен 0 или 1.

Заместители соединения настоящего изобретения, имеющего формулу (1), определяются иллюстрирующими примерами, но объем настоящего изобретения не должен

ограничиваться этими примерами.

Каждый заместитель в формуле (1) конкретно иллюстрируется далее.

Примерами (C₁-C₁₀)-алкильной группы являются метил, этил, н-пропил, изопропил, н-бутил, изобутил, втор-бутил, трет-бутил, 1-пентил, 2-пентил, 3-пентил, изопентил, неопентил, трет-пентил, 1-гексил, 2-гексил, 3-гексил, 1-метил-1-этил-н-пентил,

1,1,2-триметил-н-пропил,

1,2,2-триметил-н-пропил,

3,3-диметил-н-бутил, 1-гептил, 2-гептил, 1-этил-1,2-диметил-н-пропил, 1-этил-2,2-диметил-н-пропил, 1-октил,

3-октил, 4-метил-3-н-гептил,

6-метил-2-н-гептил, 2-пропил-1-н-гептил,

2,4,4-триметил-1-н-пентил, 1-нонил, 2-нонил,

2,6-диметил-4-н-гептил, 3-этил-2,

2-диметил-3-н-пентил, 3,5,5-триметил-1-н-гексил,

1-децил, 2-децил, 4-децил,

3,7-диметил-1-н-октил,

3,7-диметил-3-н-октил, и подобные.

Примерами (C₁-C₇)-алкильной группы являются метил, этил, н-пропил, изопропил, н-бутил, изобутил, втор-бутил, трет-бутил, 1-пентил, 2-пентил, 3-пентил, изопентил, неопентил, трет-пентил, 1-гексил, 2-гексил, 3-гексил, 1-метил-1-этил-н-пентил,

1,1,2-триметил-н-пропил,

1,2,2-триметил-н-пропил,

3,3-диметил-н-бутил, 1-гептил, 2-гептил,

1-этил-1,2-диметил-н-пропил,

1-этил-2,2-диметил-н-пропил и подобные.

Примерами (C₁-C₃)-алкильной группы являются метил, этил, н-пропил, изопропил, и подобные группы.

Примерами (C₂-C₁₀)-алкенильной группы являются этенил, 1-метил-винил, 1-пропенил, 1-метил-1-пропенил, 1-метил-2-пропенил, 2-метил-2-пропенил, 1-этил-2-винил,

1,2-диметил-1-пропенил,

1,2-диметил-2-пропенил, 1-этил-1-пропенил,

1-этил-2-пропенил, 1-метил-1-бутенил,

1-метил-2-бутенил, 2-метил-1-бутенил,

1-изопропилвинил, 1-метил-1-пентенил,

аллил, 1-бутенил, 2-бутенил, 3-бутенил,

1-пентенил, 2-пентенил, 3-пентенил,

4-пентенил, 2,4-пентадиенил, 1-гексенил,

2-гексенил, 3-гексенил, 4-гексенил,

5-гексенил, 2,4-гексадиенил, 1-гептенил,

1-октенил, 1-ноненил и подобные группы,

1-деценил.

Примерами (C₂-C₁₀)-алкинильной группы являются этинил, пропаргил, 1-бутинил, 2-бутинил, 3-бутинил, 1-пентинил, 2-пентинил, 3-пентинил, 4-пентинил, 1-гексинил, 2-гексинил, 3-гексинил, 4-гексинил, 5-гексинил, 1-гептинил, 1-октинил, 1-нонинил, 1-децинил и подобные группы.

Примерами (C₃-C₁₀)-циклоалкильной группы являются циклопропил, 1-метилциклопропил, 2-метилциклопропил, циклопропилметил, 4-метилциклогексил, циклобутил, циклопентил, циклогексил, циклогептан, циклооктан, циклононан, циклодекан, бицикло [2.2.1] гептил, бицикло [3.1.1] октил, 1-адамантил, 2-адамантил и подобные группы.

Примерами (C₃-C₇)-циклоалкильной группы являются циклопропил, 1-метилциклопропил, 2-метилциклопропил, циклопропилметил, 4-метилциклогексил,

циклобутил, циклопентил, циклогексил, циклогептил и подобные группы.

Примерами (C_3-C_7)-циклоалкенильной группы являются 1-циклогексенил, 2-циклогексенил, 3-циклогексенил, цикlopentadiенил, 2-бицикло [2.2.1] гептенил, 2,5-бицикло [2.2.1] гептадиенил и подобные группы.

Примерами (C_1-C_7)-алкоксигруппы являются метоксигруппа, этоксигруппа, н-пропоксигруппа, изопропоксигруппа, н-бутоксигруппа, изобутоксигруппа, втор-бутоксигруппа, трет-бутоксигруппа, пентилоксигруппа, гексилоксигруппа, гептилоксигруппа и подобные группы.

Примерами замещенной силильной группы являются триметилсилил, триэтилсилил, три-н-пропилсилил, три-изопропилсилил, три-н-бутилсилил, три-изобутилсилил, три-н-гексилсилил, диметилэтилсилил, диметил-н-пропилсилил, диметил-н-бутилсилил, ди-метилизобутилсилил, диметил-трет-бутилсилил, диметил-н-пентилсилил, диметил-н-октилсилил, диметилциклогексилсилил, ди-метилгексилсилил, диметил-2,3-диметилпропилсилил, диметил-2-(бициклогептил)силил, диметилбензилсилил, диметилфенилсилил, диметил-п-толилсилил, диметилфлюоремилсилил, метилдифенилсилил, трифенилсилил, дифенил-трет-бутилсилил, трибензилсилил, дифенилвинилсилил, дифенил-н-бутилсилил, фенилметилвинилсилил и подобные группы.

Примерами (C_1-C_{14})-алифатической ацильной группы являются формил, ацетил, пропионил, бутирил, изобутирил, валерил, изовалерил, пивалоил, лауроил, миристоил, акрилоил, пропиолоил, метакрилоил, кротоноил и подобные группы.

Примерами (C_6-C_{10})-ароматической ацильной группы являются бензоил, 2-толуоил, 3-толуоил, 4-толуоил, α -нафтоил, β -нафтоил, циннамоил и подобные группы.

Примерами (C_6-C_{14})-ароматической группы являются фенил, α -нафтил, β -нафтил, 1-инденил, 2-инденил, 3-инденил, 4-инденил, 5-инденил, 6-инденил, 7-инденил, 1-инданил, 2-инданил, 4-инданил, 5-инданил, 1-флуоренил, 2-флуоренил, 3-флуоренил, 4-флуоренил, 9-флуоренил и подобные группы.

Примерами (C_4-C_{12})-гетероциклической ароматической группы являются 2-фурил, 3-фурил, 2-тиенил, 3-тиенил, 1-пирролил, 2-пирролил, 3-пирролил, 2-оксазолил, 4-оксазолил, 5-оксазолил, 2-тиазолил, 4-тиазолил, 5-тиазолил, 3-изоксазолил, 4-изоксазолил, 5-изоксазолил, 3-изотиазолил, 4-изотиазолил, 5-изотиазолил, 3-фуразанил, 1-пиразолил, 3-пиразолил, 4-пиразолил, 3-оксопиразол-1-ил, 3-оксопиразол-2-ил, 3-оксопиразол-3-ил, 3-оксопиразол-4-ил, 4-оксопиразол-3-ил, 1-имидазолил, 2-имидазолил, 4-имидазолил, 2-оксоимидазол-1-ил, 2-оксоимидазол-4-ил, 1,2,3-триазол-1-ил, 1,2,3-триазол-2-ил, 1,2,3-триазол-4-ил, 1,2,4-триазол-1-ил, 1,2,4-триазол-3-ил, 1,2,4-триазол-4-ил, 1,2,4-(2H, 4H)-триазол-3-он-2-ил, 1,2,4-(2H,

4H)-триазол-3-он-4-ил, 1,2,4-(2H, 4H)-триазол-3-он-5-ил, 1,2,4(1H, 2H)-триазол-3-он-1-ил, 1,2,4-(1H, 2H)-триазол-3-он-2-ил, 1,2,4 (1H, 2H)-триазол-3-он-5-ил, 1-тетразолил, 2-тетразолил, 5-тетразолил, 2-пиранил, 3-пиранил, 4-пиранил, 2-пиридил, 3-пиридил, 4-пиридил, 2-пиридон-1-ил, 2-пиридон-3-ил, 2-пиридон-4-ил, 2-пиридон-5-ил, 2-пиридон-6-ил, 4-пиридон-1-ил, 4-пиридон-2-ил, 4-пиридон-3-ил, 3-пиридазинил, 4-пиридазинил, 3(2H)-пиридазинон-2-ил, 3(2H)-пиридазинон-4-ил, 3(2H)-пиридазинон-5-ил, 3(2H)-пиридазинон-6-ил, 4(1H)-пиридазинон-1-ил, 4(1H)-пиридазинон-3-ил, 4(1H)-пиридазинон-5-ил, 4(1H)-пиридазинон-6-ил, 2-пиримидинил, 4-пиримидинил, 5-пиримидинил, 2(1H)-пирими-динон-1-ил, 2(1H)-пиримидинон-4-ил, 2(1H)-пиримидинон-5-ил, 2(1H)-пиримидинон-6-ил, 4(3H)-пиримидинон-2-ил, 4(3H)-пиримидинон-3-ил, 4(3H)-пиримидинон-5-ил, 4(3H)-пиримидинон-6-ил, 4(1H)-пиримидинон-1-ил, 4(1H)-пиримидинон-2-ил, 4(1H)-пиримидинон-5-ил, 4(1H)-пиримидинон-6-ил, 2-пиразинил, 2(1H)-пиразин-1-ил, 2(1H)-пиразин-3-ил, 2(1H)-пиразин-5-ил, 2(1H)-пиразин-6-ил, 1,2,3-триазин-4-ил, 1,2,3-триазин-5-ил, 1,2,4-триазин-3-ил, 1,2,4-триазин-5-ил, 1,2,4-триазин-6-ил, 1,2,3,4-тетразин-5-ил, 1,2,4,5-тетразин-3-ил, 1-индолил, 2-индолил, 3-индолил, 4-индолил, 5-индолил, 6-индолил, 7-индолил, 2-хинолил, 3-хинолил, 4-хинолил, 5-хинолил, 6-хинолил, 7-хинолил, 8-хинолил, 2-хинолон-1-ил, 2-хинолон-3-ил, 2-хинолон-4-ил, 2-хинолон-5-ил, 2-хинолон-6-ил, 2-хинолон-7-ил, 2-хинолон-3-ил, 4-хинолон-1-ил, 4-хинолон-2-ил, 4-хинолон-3-ил, 4-хинолон-5-ил, 4-хинолон-6-ил, 4-хинолон-7-ил, 4-хинолон-8-ил, 2-бензофуранил, 3-бензофуранил, 4-бензофуранил, 5-бензофуранил, 6-бензофуранил, 7-бензофуранил, 2-бензотиенил, 3-бензотиенил, 4-бензотиенил, 5-бензотиенил, 6-бензотиенил, 7-бензотиенил, 1-изохинолил, 3-изохинолил, 4-изохинолил, 5-изохинолил, 6-изохинолил, 7-изохинолил, 8-изохинолил, 1-изохинолон-2-ил, 1-изохинолон-3-ил, 1-изохинолон-4-ил, 1-изохинолон-5-ил, 1-изохинолон-6-ил, 1-изохинолон-7-ил, 1-изохинолон-8-ил, 3-изохинолон-2-ил, 3-изохинолон-4-ил, 3-изохинолон-5-ил, 3-изохинолон-6-ил, 3-изохинолон-7-ил, 3-изохинолон-8-ил, 2-бензоксазолил, 4-бензоксазолил, 5-бензоксазолил, 6-бензоксазолил, 7-бензоксазолил, 2-бензотиазолил, 4-бензотиазолил, 5-бензотиазолил, 6-бензотиазолил, 7-бензотиазолил, 1-бензопиразолил, 2-бензопиразолил, 3-бензопиразолил, 4-бензопиразолил, 5-бензопиразолил, 6-бензопиразолил, 7-бензопиразолил, 1-бензимидазолил, 2-бензимидазолил, 4-бензимидазолил, 5-бензимидазолил, 1-бензотриазолил, 4-бензотриазолил, 5-бензотриазолил, 2-бензопиранил, 3-бензопиранил, 4-бензопиранил, 5-бензопиранил,

6-бензопиранил, 7-бензопиранил, 8-бензопиранил, 1-индолизинил, 2-индолизинил, 3-индолизинил, 5-индолизинил, 6-индолизинил, 7-индолизинил, 8-индолизинил, 2-пуририл, 6-пуририл, 7-пуририл, 8-пуририл, 1-фалазинил, 5-фалазинил, 6-фалазинил, 1-оксо-фалазин-2-ил, 1-оксофалазинил-4-ил, 1-оксофалазин-5-ил, 1-оксофалазин-6-ил, 1-оксофалазин-7-ил, 1-оксофалазин-8-ил, 2-нафтиридинил, 3-нафтиридинил, 4-нафтиридинил, 2-хиноксалинил, 5-хиноксалинил, 6-хиноксалинил, 2-хиназолинил, 4-хиназолинил, 5-хиназолинил, 6-хиназолинил, 7-хиназолинил, 8-хиназолинил, 3-циннолинил, 4-циннолинил, 5-циннолинил, 6-циннолинил, 7-циннолинил, 8-циннолинил, 1,4-бензодиоксан-2-ил, 1,4-бензодиоксан-5-ил, 1,4-бензодиоксан-6-ил, 1,4-оксонафталин-2-ил, 1,4-оксонафталин-5-ил, 1,4-оксонафталин-6-ил, 2,3-дигидро-4-бензофуранил, 2,3-дигидро-5-бензофуранил, 2,3-дигидро-6-бензо-фуранил, 2,3-дигидро-7-бензофуранил, 1,4-бензотиазин-2-ил, 1,4-бензотиазин-3-ил, 1,4-бензотиазин-4-ил, 1,4-бензотиазин-5-ил, 1,4-бензотиазин-6-ил, 1,4-бензотиазин-7-ил, 1,4-бензотиазин-8-ил, 2-птеридинил, 4-птеридинил, 6-птеридинил, 7-птеридинил, пиразоло [1,5-а] пиримидин-2-ил, пиразоло [1,5-а] пиримидин-3-ил, пиразоло [1,5-а] пиримидин-5-ил, пиразоло [1,5-а] пиримидин-6-ил, пиразоло [1,5-а] пиримидин-7-ил, пиразоло [5,1-с] [1,2,4] триазин-3-ил, пиразоло [5,1-с] [1,2,4] триазин-4-ил, пиразоло [5,1-с] [1,2,4] триазин-7-ил, пиразоло [5,1-с] [1,2,4] триазин-8-ил, тиазоло [3,2-б] триазол-2-ил, тиазоло [3,2-б] триазол-5-ил, тиазоло [3,2-б] триазол-6-ил, бензопирано [2,3-б] пиридин-2-ил, бензопирано [2,3-б] пиридин-3-ил, бензопирано [2,3-б] пиридин-4-ил, бензопирано [2,3-б] пиридин-5-ил, бензопирано [2,3-б] пиридин-6-ил, бензопирано [2,3-б] пиридин-7-ил, бензопирано [2,3-б] пиридин-8-ил, бензопирано [2,3-б] пиридин-9-ил, 5Н-бензопирано [2,3-б] пиридин-5-он-2-ил, 5Н-бензопирано [2,3-б] пиридин-5-он-3-ил, 3Н-бензопирано [2,3-б] пиридин-5-он-4-ил, 5Н-бензопирано [2,3-б] пиридин-5-он-6-ил, 5Н-бензопирано [2,3-б] пиридин-5-он-7-ил, 5Н-бензопирано [2,3-б] пиридин-5-он-8-ил, 1-ксантенил, 2-ксантенил, 3-ксантенил, 4-ксантенил, 9-ксантенил, 1-феноксатиинил, 2-феноксатиинил, 3-феноксатиинил, 4-феноксатиинил, 1-карбазолил, 2-карбазолил, 3-карбазолил, 4-карбазолил, 9-карбазолил, 1-акридинил, 2-акридинил, 3-акридинил, 4-акридинил, 9-акридинил, 1-феназинил, 2-феназинил, 3-феназинил, 4-феназинил, 1-фенотиазинил, 2-фенотиазинил, 3-фенотиазинил, 4-фенотиазинил, 10-фенотиазинил, 1-феноксазинил, 2-феноксазинил, 3-феноксазинил, 4-феноксазинил, 10-феноксазинил, 1-тиантренил, 2-тиантренил, 3-тиантренил, 4-тиантренил, 6-тиантренил, 7-тиантренил, 8-тиантренил, 9-тиантренил и подобные группы.

Примерами (C₄-C₆)-

гетероциклоолифатической группы являются 1-пиперидил, 2-пиперидил, 3-пиперидил, 4-пиперидил, 1-пирролидинил, 2-пирролидинил, 3-пирролидинил, 1-имидазолидинил, 2-имидазолидинил, 4-имидазолидинил, 1-пиразолидинил, 3-пиразолидинил, 4-пиразолидинил, 2-морфолинил, 3-морфолинил, 4-морфолинил, 2-тетрагидрофуранил, 3-тетрагидрофуранил и подобные группы.

В настоящем описании "н" ("n") означает нормальный, "изо" ("i") означает изосоединение, "втор" ("s") означает вторичный, "трет" ("t") означает третичный, "с" означает "цикло"/ ц-1. "Me" означает метил, "Et" означает этил, "Pr" означает пропил. "Bu" означает бутил, "Pen" означает пентил, "Hex" означает гексил, "Ph" означает фенил, и "Hal" означает галоген.

Среди этих соединений существуют соединения, имеющие асимметричный атом углерода в положении 5 тиазолидинового кольца. Соединения, имеющие приведенную выше формулу (1), включают все эти оптические изомеры и их смеси.

Далее описываются предпочтительные примеры с (1) по (10) соединений формулы (1) настоящего изобретения.

(1) Соединение тиазолидина пиридинового типа формулы (1) и его соль, в которых

X² представляет собой S или O;

Y представляет собой

CR⁶R⁷/R⁶ представляет собой атом водорода или (C₁-C₃)-алкильную группу, и R⁷ представляет собой атом водорода или (C₁-C₃)-алкильную группу, или вместе с R⁴ образует связь);

Z представляет собой -A-B/A представляет собой двухвалентную насыщенную (C₁-C₆)-или ненасыщенную (C₂-C₆)-углеводородную группу, которая может замещаться самое большее 3 гидроксильными, оксо- и (C₁-C₇)-алкильными группами и В представляет собой (C₃-C₁₀)-циклоалкильную, (C₃-C₇)-циклоалкенильную, (C₆-C₁₄)-ароматическую и (C₄-C₁₂)-гетероциклическую ароматическую

группу, которые, в целом, могут быть замещены самое большее 5 заместителями (упомянутая гетероциклическая ароматическая группа может содержать самое большее 5 гетероатомов, выбираемых из группы, состоящей из атома кислорода, атома серы и атома азота, как составляющих элементов гетероциклического ядра), или (C₄-C₆)-гетероциклоолифатическую группу (упомянутая гетероциклоолифатическая группа может содержать самое большее 3 гетероатома, выбираемых из группы, состоящей из атома кислорода, атома серы и атома азота, в качестве составляющих элементов гетероциклического ядра)).

Причем среди групп В упомянутая (C₃-C₁₀)-циклоалкильная группа представляет собой циклопропил, циклобутил, циклопентил, циклогексил, циклогептан, циклооктан, циклононан, циклодекан, бицикло [2.2.1] гептил, бицикло [3.1.1] гептил, бицикло [2.2.2] октил, 1-адамантил или 2-адамантил, упомянутая (C₃-C₇)-циклоалкенильная группа

представляет собой 1-циклогексенил, 2-циклогексенил, 3-циклогексенил, цикlopentadiенил, 2-бицикло [2.2.1] гептенил или 2,5-бицикло [2.2.1] гептадиенил, упомянутая (C₆-C₁₄)-ароматическая группа представляет собой фенил, α-нафтил, β-нафтил, 1-инденил, 2-инденил, 3-инденил, 4-инденил, 5-инденил, 6-инденил, 7-инденил, 1-инданил, 2-инданил, 4-инданил, 5-инданил, 1-флуоренил, 2-флуоренил, 3-флуоренил, 4-флуоренил или 9-флуоренил, упомянутая (C₄-C₁₂)-гетероциклическая ароматическая группа представляет собой 2-фурил, 3-фурил, 2-тиенил, 3-тиенил, 1-пирролил, 2-пирролил, 3-пирролил, 2-оксазолил, 4-оксазолил, 5-оксазолил, 2-тиазолил, 4-тиазолил, 5-тиазолил, 3-изоксазолил, 4-изоксазолил, 5-изоксазолил, 3-изотиазолил, 4-изотиазолил, 5-изотиазолил, 3-фуразанил, 1-пиразолил, 3-пиразолил, 4-пиразолил, 3-оксопиразол-1-ил, 3-оксопиразол-2-ил, 3-оксопиразол-3-ил, 3-оксопиразол-4-ил, 4-оксопиразол-3-ил, 1-имидазолил, 2-имидазолил, 4-имидазолил, 2-оксоимидазол-1-ил, 2-оксоимидазол-4-ил, 1,2,3-триазол-1-ил, 1,2,3-триазол-2-ил, 1,2,3-триазол-4-ил, 1,2,4-триазол-1-ил, 1,2,4-триазол-3-ил, 1,2,4-триазол-4-ил, 1,2,4(2H, 4H)-триазол-3-он-2-ил, 1,2,4(2H, 4H)-триазол-3-он-4-ил, 1,2,4(2H, 4H)-триазол-3-он-5-ил, 1,2,4(1H, 2H)-триазол-3-он-1-ил, 1,2,4(1H, 2H)-триазол-3-он-2-ил, 1,2,4(1H, 2H)-триазол-3-он-5-ил, 1-тетразолил, 2-тетразолил, 5-тетразолил, 2-пиранил, 3-пиранил, 4-пиранил, 2-пиридил, 3-пиридил, 4-пиридил, 2-пиридон-1-ил, 2-пиридон-3-ил, 2-пиридон-4-ил, 2-пиридон-5-ил, 2-пиридон-6-ил, 4-пиридон-1-ил, 4-пиридон-2-ил, 4-пиридон-3-ил, 3-пиридазинил, 4-пиридазинил, 3(2H)-пиридазинон-2-ил, 3(2H)-пиридазинон-4-ил, 3(2H)-пиридазинон-5-ил, 3(2H)-пиридазинон-6-ил, 4(1H)-пиридазинон-1-ил, 4(1H)-пиридазинон-3-ил, 4(1H)-пиридазинон-5-ил, 4(1H)-пиридазинон-6-ил, 2-пиримидинил, 4-пиримидинил, 5-пиримидинил, 2(1H)-пиримидинон-1-ил, 2(1H)-пиримидинон-4-ил, 2(1H)-пиримидинон-5-ил, 2(1H)-пиримидинон-6-ил, 4(3H)-пиримидинон-2-ил, 4(3H)-пиримидинон-3-ил, 4(3H)-пиримидинон-5-ил, 4(3H)-пиримидинон-6-ил, 4(1H)-пиримидинон-1-ил, 4(1H)-пиримидинон-2-ил, 4(1H)-пиримидинон-5-ил, 4(1H)-пиримидинон-6-ил, 2-пиазинил, 2(1H)-пиазин-1-ил, 2(1H)-пиазин-3-ил, 2(1H)-пиазин-5-ил, 2(1H)-пиазин-6-ил, 1,2,3-триазин-4-ил, 1,2,3-триазин-5-ил, 1,2,4-триазин-3-ил, 1,2,4-триазин-5-ил, 1,2,4-триазин-6-ил, 1,2,3,4-тетразин-5-ил, 1,2,4,5-тетразин-3-ил, 1-индолил, 2-индолил, 3-индолил, 4-индолил, 5-индолил, 6-индолил, 7-индолил, 2-хинолил, 3-хинолил, 4-хинолил, 5-хинолил, 6-хинолил, 7-хинолил, 8-хинолил, 2-хинолон-1-ил, 2-хинолон-3-ил, 2-хинолон-4-ил, 2-хинолон-5-ил, 2-хинолон-6-ил, 2-хинолон-7-ил, 2-хинолон-8-ил, 4-хинолон-1-ил, 4-хинолон-2-ил, 4-хинолон-3-ил, 4-хинолон-5-ил, 4-хинолон-6-ил,

4-хинолон-7-ил, 4-хинолон-8-ил, 2-бензо-фуранил, 3-бензофуранил, 4-бензофуранил, 5-бензофуранил, 6-бензофуранил, 7-бензофуранил, 2-бензотиенил, 3-бензотиенил, 4-бензотиенил, 5-бензотиенил, 6-бензотиенил, 7-бензотиенил, 1-изохинолил, 3-изохинолил, 4-изохинолил, 5-изохинолил, 6-изохинолил, 7-изохинолил, 8-изохинолил, 1-изохинолон-2-ил, 1-изохинолон-3-ил, 1-изохинолон-4-ил, 1-изохинолон-5-ил, 1-изохинолон-6-ил, 1-изохинолон-7-ил, 1-изохинолон-8-ил, 3-изохинолон-2-ил, 3-изохинолон-4-ил, 3-изохинолон-5-ил, 3-изохинолон-6-ил, 3-изохинолон-7-ил, 3-изохинолон-8-ил, 2-бензоксазолил, 4-бензоксазолил, 5-бензоксазолил, 6-бензоксазолил, 7-бензоксазолил, 2-бензотиазолил, 4-бензотиазолил, 5-бензотиазолил, 6-бензотиазолил, 7-бензотиазолил, 1-бензопиразолил, 2-бензопиразолил, 3-бензопиразолил, 4-бензопиразолил, 5-бензопиразолил, 6-бензопиразолил, 7-бензопиразолил, 1-бензимидазолил, 2-бензимидазолил, 4-бензимидазолил, 5-бензимидазолил, 1-бензотриазолил, 4-бензотриазолил, 5-бензотриазолил, 2-бензопиранил, 3-бензопиранил, 4-бензопиранил, 5-бензопиранил, 6-бензопиранил, 7-бензопиранил, 8-бензопиранил, 1-индолизинил, 2-индолизинил, 3-индолизинил, 5-индолизинил, 6-индолизинил, 7-индолизинил, 8-индолизинил, 2-пуринил, 6-пуринил, 7-пуринил, 8-пуринил, 1-фталазинил, 5-фталазинил, 6-фталазинил, 1-оксофталазин-2-ил, 1-оксофталазин-4-ил, 1-оксофталазин-5-ил, 1-оксофталазин-6-ил, 1-оксофталазин-7-ил, 1-оксофталазин-8-ил, 2-нафтиридинил, 3-нафтиридинил, 4-нафтиридинил, 2-хиноксалинил, 5-хиноксалинил, 6-хиноксалинил, 2-хиназолинил, 4-хиназолинил, 5-хиназолинил, 6-хиназолинил, 7-хиназолинил, 8-хиназолинил, 3-циннолинил, 4-циннолинил, 5-циннолинил, 6-циннолинил, 7-циннолинил, 8-циннолинил, 1,4-бензодиоксан-2-ил, 1,4-бензодиоксан-5-ил, 1,4-бензодиоксан-6-ил, 1,4-оксонафталин-2-ил, 1,4-оксонафталин-5-ил, 1,4-оксонафталин-6-ил, 2,3-дигидро-4-бензофуранил, 2,3-дигидро-5-бензофуранил, 2,3-дигидро-6-бензофуранил, 2,3-дигидро-7-бензофуранил, 1,4-бензотиазин-2-ил, 1,4-бензотиазин-3-ил, 1,4-бензотиазин-4-ил, 1,4-бензотиазин-5-ил, 1,4-бензотиазин-6-ил, 1,4-бензотиазин-7-ил, 1,4-бензотиазин-8-ил, 2-птеридинил, 4-птеридинил, 6-птеридинил, 7-птеридинил, пиазоло [1,5-а] пиримидин-2-ил, пиазоло [1,5-а] пиримидин-3-ил, пиазоло [1,5-а] пиримидин-5-ил, пиазоло [1,5-а] пиримидин-6-ил, пиазоло [1,5-а] пиримидин-7-ил, пиазоло [5,1-с] [1,2,4] триазин-3-ил, пиазоло [5,1-с] [1,2,4] триазин-4-ил, пиазоло [5,1-с] [1,2,4] триазин-7-ил, пиазоло [5,1-с] [1,2,4] триазин-8-ил, тиазоло [3,2-б] триазол-2-ил, тиазоло [3,2-б] триазол-5-ил, тиазоло [3,2-8] триазол-6-ил, бензопирано [2,3-б]-пиридин-2-ил, бензопирано [2,3-б] пиридин-3-ил, бензопирано [2,3-б] пиридин-4-ил, бензопирано [2,3-б]

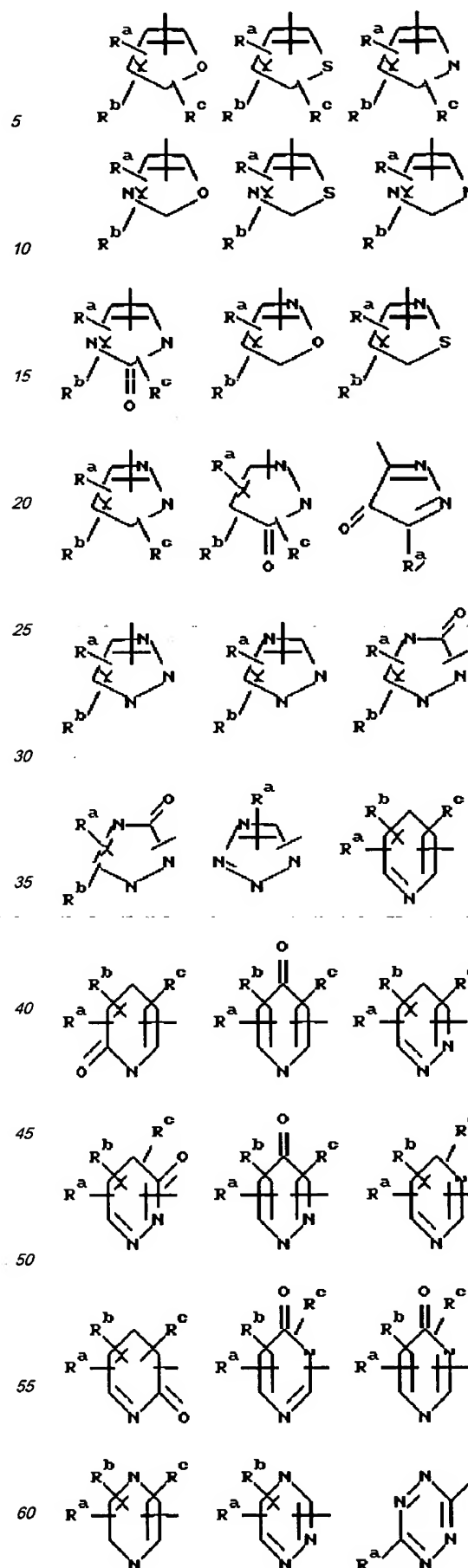
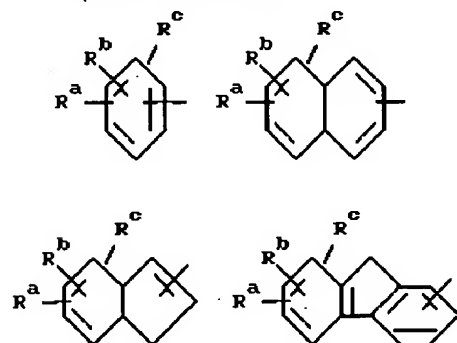
пиридин-5-ил, бензопирано [2,3-b]
 пиридин-6-ил, бензопирано [2,3-b]
 пиридин-7-ил, бензопирано [2,3-b]
 пиридин-8-ил, бензопирано [2,3-b]
 пиридин-9-ил, 5Н-бензопирано [2,3-b]
 пиридин-5-он-2-ил, 5Н-бензопирано [2,3-b]
 пиридин-5-он-3-ил, 5Н-бензопирано [2,3-b]
 пиридин-5-он-4-ил, 5Н-бензопирано [2,3-b]
 пиридин-5-он-6-ил, 5Н-бензопирано [2,3-b]
 пиридин-5-он-7-ил, 5Н-бензопирано [2,3-b]
 [2,3-b]-пиридин-5-он-8-ил, 1-ксантенил,
 2-ксантенил, 3-ксантенил, 4-ксантенил,
 9-ксантенил, 1-феноксатиинил,
 2-феноксатиинил, 3-феноксатиинил,
 4-феноксатиинил, 1-карбазолил,
 2-карбазолил, 3-карбазолил, 4-карбазолил,
 9-карбазолил, 1-акридинил, 2-акридинил, 3-акридинил,
 4-акридинил, 9-акридинил,
 1-феназинил, 2-феназинил, 3-феназинил,
 4-феназинил, 1-фенотиазинил,
 2-фенотиазинил, 3-фенотиазинил,
 4-фенотиазинил, 10-фенотиазинил,
 1-феноксазинил, 2-феноксазинил, 3-феноксазинил,
 4-феноксазинил, 10-феноксазинил, 1-тиантренил,
 2-тиантренил, 3-тиантренил, 4-тиантренил,
 6-тиантренил, 7-тиантренил, 8-тиантренил
 или 9-тиантренил, и упомянутая (C₄-C₆)-гетероциклоалифатическая группа представляет собой 1-пиперидил, 2-пиперидил, 3-пиперидил, 4-пиперидил, 1-пирролидинил, 2-пирролидинил, 3-пирролидинил, 1-имидазолидинил, 2-имидазолидинил, 4-имидазолидинил, 1-пиразолидинил, 3-пиразолидинил, 4-пиразолидинил, 2-морфолинил, 3-морфолинил, 4-морфолинил, 2-тетрагидрофуранил или 3-тетрагидрофуранил;

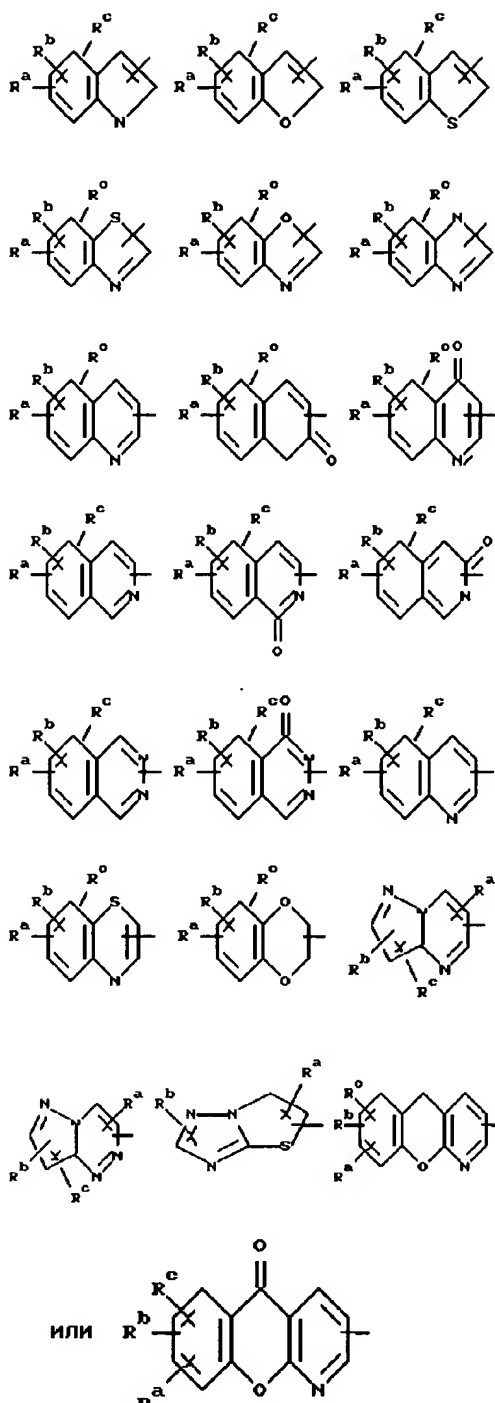
каждый из R¹, R² и R³, независимо, представляет собой атом водорода, (C₁-C₃)-алкильную группу (которая может быть замещена гидроксильной группой), гидроксильную группу или атом галогена;

R⁴ представляет собой атом водорода или (C₁-C₃)-алкильную группу, или вместе с R⁷ образует связь; и n равен 0.

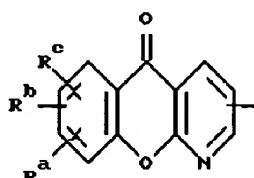
(2) Соединение тиазолидина пиридинового типа формулы (I) и его соль, в которых каждый из R¹, R² и R³, независимо, представляет собой атом водорода, метильную группу, гидроксильную группу или атом хлора; и

В представляет собой





или



(где каждый из R^a и R^b , независимо, представляет собой атом водорода, (C₁-C₇)-алкильную группу, (C₃-C₇)-циклоалкильную группу, (C₃-C₇)-циклоалкенильную группу (упомянутые алкильная, циклоалкильная и циклоалкенильная группы могут быть замещены гидроксильной группой), гидроксильную группу, (C₁-C₇)-алкоксигруппу, (C₁-C₇)-алкилтиогруппу, атом фтора, атом хлора, атом брома, трифторметильную группу, нитрогруппу, аминогруппу, метиламиногруппу, диметиламиногруппу, ацетамидную группу, метансульфонамидную группу, карбоксильную группу, (C₁-C₃)-алкоксикарбонильную группу, нитрильную группу, карбамоильную группу,

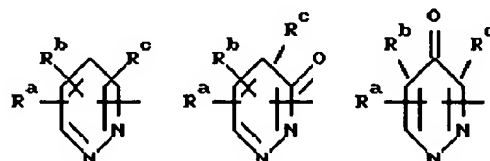
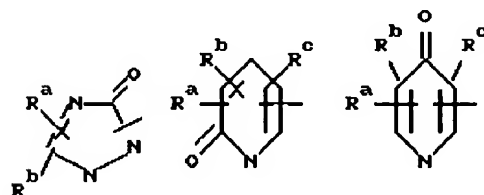
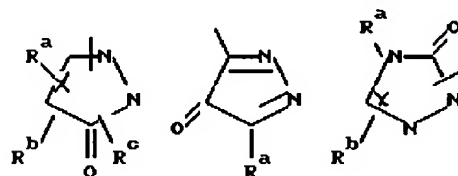
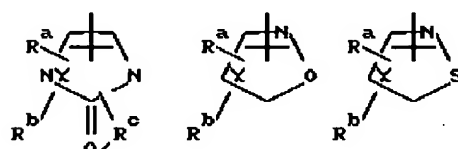
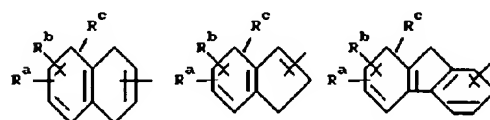
сульфамоильную группу, феноксигруппу, бензилоксигруппу, фенил, β -нафтил, α -нафтил, фуранил, тиенил, имидазолил, пиридил или бензильную группу (каждая из упомянутых фенильной, α -нафтильной, β -нафтильной, фуранильной, тиенильной, имидазолильной, пиридиной и бензильной групп может быть замещена самое большее 5 заместителями, выбираемыми из группы, состоящей из метила, этила, н-пропила, изопропила, циклопропила, н-бутила, изобутила, втор-бутила, трет-бутила, н-гексила, циклогексила, метоксигруппы, этоксигруппы, н-пропоксигруппы, изопропоксигруппы, метилтиогруппы, этилтиогруппы, н-пропилтиогруппы, изопропилтиогруппы, гидроксильной группы, атомов фтора, хлора, брома, нитрогруппы и диметиламиногруппы), 1-тетразолильную группу, 3-тетразолильную группу, 5-тетразолильную группу, тиазолидиндион-5-ильную группу или тиазолидиндион-5-илметильную группу,

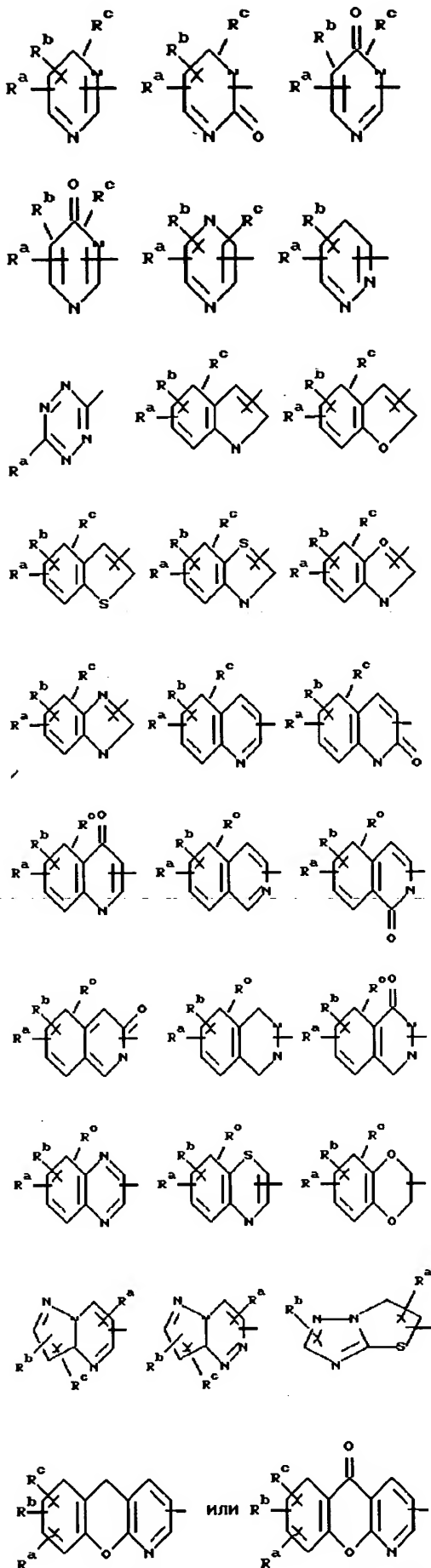
и R^c представляет собой атом водорода, (C₁-C₇)-алкильную группу, (C₃-C₇)-циклоалкильную группу или гидроксиметильную группу).

(3) Соединение тиазолидина пиридинового типа формулы (1) и его соль, в которых

каждый из R^1 , R^2 и R^3 , независимо, представляет собой атом водорода, метильную группу, гидроксильную группу или атом хлора; и

В представляет собой





- (C₁-C₇)-алкильную группу,
 (C₃-C₇)-циклоалкильную группу,
 (C₃-C₇)-циклоалкенильную группу
 (упомянутые алкильная, циклоалкильная и циклоалкенильная группы могут быть замещены гидроксильной группой), гидроксильную группу,
 (C₁-C₇)-алкоксигруппу,
 (C₁-C₇)-алкилтиогруппу, атом фтора, атом хлора, атом брома, трифторметильную группу, нитрогруппу, аминогруппу, метиламиногруппу, диметиламиногруппу, ацетамидную группу, метансульфониламидную группу, карбоксильную группу,
 (C₁-C₃)-алкоксикарбонильную группу, нитрильную группу, карбамоильную группу, сульфоамидную группу, феноксигруппу, бензилоксигруппу, фенильную, α-нафтильную, β-нафтильную, фуранильную, тиенильную, имидазолильную, пиридинильную или бензильную группу (упомянутые фенильная, α-нафтильная, β-нафтильная, фуранильная, тиенильная, имидазолильная, пиридинильная и бензильная группы могут быть замещены самое большее 5 заместителями, выбираемыми из группы, состоящей из метильной, этильной, n-пропильной, изопропильной, циклопропильной, n-бутильной, изобутильной, втор-бутильной, трет-бутильной, n-гексильной, циклогексильной группы, метоксигруппы, этоксигруппы, n-пропоксигруппы, изопропоксигруппы, метилтиогруппы, этилтиогруппы, n-пропилтиогруппы, изопропилтиогруппы, гидроксильной группы, атомов фтора, хлора, брома, нитрогруппы и диметиламиногруппы), 1-тетразолильную группу, 3-тетразолильную группу, 5-тетразолильную группу, тиазолидиндион-5-ильную группу или тиазолидиндион-5-илметильную группу, и R^c представляет собой атом водорода, (C₁-C₇)-алкильную группу, (C₃-C₇)-циклоалкильную группу или гидросиметильную группу).
 Соединение тиазолидина пиридинового типа формулы (1) и его соль, в которых X^1 представляет собой S, R^1 , R^2 и R^3 являются атомами водорода; Y представляет собой CR^6/R^6 представляет собой атом водорода или метильную группу, и R^7 представляет собой атом водорода или вместе с R^4 образует связь; R^4 представляет собой атом водорода или метильную группу, или вместе с R^7 образует связь; и A представляет собой двухвалентную насыщенную (C₁-C₆)- или ненасыщенную (C₂-C₆)-углеводородную группу, которая может быть замещена самое большее 2 гидроксильными, оксо- и (C₁-C₇)-алкильными группами (при условии, что первый атом углерода, связанный с атомом кислорода в положении 5 пиридинового кольца соединения формулы (1), не замещается гидроксильной группой или оксогруппой).
 (5) Соединение тиазолидина пиридинового типа формулы (1) и его соль, в которых Y представляет собой -CH₂-; и R^4 представляет собой атом водорода.

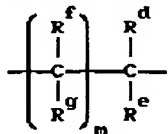
(6) Соединение тиазолидина пиридинового типа формулы (1) и его соль, в которых

Y представляет собой CHR⁷/R⁷ образует связь вместе с R⁴; и

R⁴ образует связь вместе с R⁷.

(7) Соединение тиазолидина пиридинового типа формулы (1) и его соль, в которых

A представляет собой

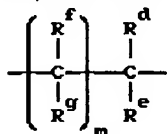


(где m составляет от 0 до 5, каждый R^d и R^e, независимо, представляет собой атом водорода или метильную группу, и

каждый из R^f и R^g, независимо, представляет собой атом водорода, метильную группу или гидроксильную группу, или R^f и R^g вместе образуют оксогруппу, или соседние R^d и R^f вместе образуют двойную связь, или соседние R^d, R^f, R^e и R^g вместе образуют тройную связь, или соседние группы R^f, S образуют вместе двойную связь, когда m равен от 2 до 5, или соседние R^f и R^g вместе образуют тройную связь).

(8) Соединение тиазолидина пиридинового типа формулы (1) и его соль, в которых

A представляет собой



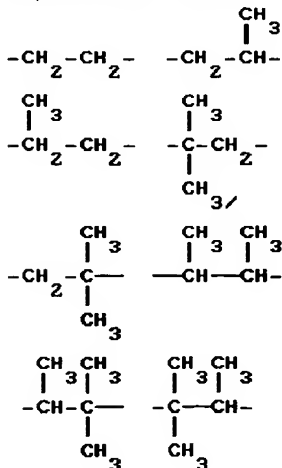
(где m равен 0-2,

каждый из R^d и R^e, независимо, представляет собой атом водорода, или метильную группу, и

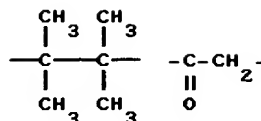
каждый из R^f и R^g, независимо, представляет собой атом водорода, метильную группу или гидроксильную группу, или R^f и R^g вместе образуют оксогруппу, или соседние R^d и R^f вместе образуют двойную связь, или соседние R^d, R^f, R^e и R^g вместе образуют тройную связь, или соседние группы R^f, S образуют вместе двойную связь, когда m равен 2, или соседние R^f и R^g вместе образуют тройную связь.

(9) Соединение тиазолидина пиридинового типа формулы (1) и его соль, в которых

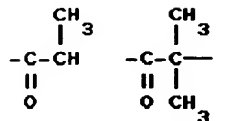
A представляет собой



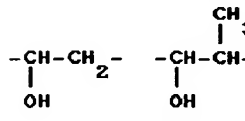
5



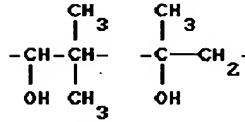
10



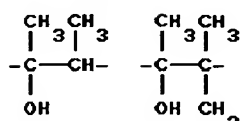
15



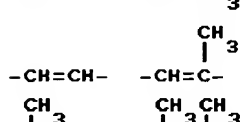
20



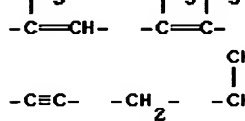
25



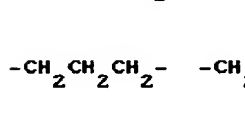
30



35



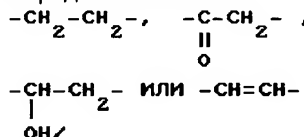
40



или -CH=CH-CH₂-

(10) Соединение тиазолидина пиридинового типа формулы I, и его соль, в которых

A представляет собой



45

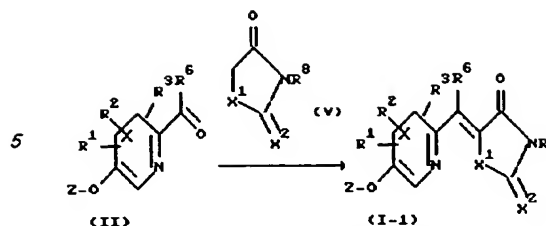
Так как соединение настоящего изобретения, имеющее вышеприведенную формулу (I), включает как кислотный водород в тиазолидиновом кольце, так и основной азот в пиридиновом кольце в молекуле, оно может образовывать при желании фармацевтически приемлемые нетоксичные соли с соответствующим основанием или кислотой. Соединение формулы (I) может использоваться для целей настоящего изобретения либо в свободной форме, либо в форме фармацевтически приемлемой соли. Примерами основных солей являются соли щелочных металлов (литиевая соль, натриевая соль, калиевая соль и подобные), соли щелочноземельных металлов (кальциевая соль, магниевая соль и т.п.), соли алюминия, аммониевые соли, которые могут быть незамещенными или замещенными метильной, этильной или бензильной группой, соли органических аминов (соль метиламина, соль этиламина, соль диметиламина, соль диэтиламина, соль триметиламина, соль триэтиламина, соль циклогексиламина, соль этилендиамина, соль

бициклогексиламина, соль этаноламина, соль диэтанолламина, соль триэтанолламина, соль пиперазина, соль дибензилпиперидина, соль дегидроабиетиламина, соль N,N'-бисдегидроабиетиламина, соль бензатин (N,N'-дибензилэтилендиамин), соль глюкамина, соль меглумин (N-метилглюкамина), соль бенетамин (N-бензилфенетиламина), соль трометамин (2-амино-2-гидроксиэтил-1,3-пропандиол), соль холина, соль прокаина, соли основных аминокислот (соль лизина, соль орнитина, соль аргинина и т. п.), соли пиридина, соли коллидина, соли хинолина и подобные соли. Примеры солей присоединения кислот включают соли минеральных кислот (гидрохлориды, гидробромиды, сульфаты, гидросульфаты, нитраты, фосфаты, гидрофосфаты, дигидрофосфаты и подобные), соли органических кислот (формиаты, ацетаты, пропионаты, сукцинаты, малонаты, оксалаты, малеаты, фумараты, малаты, цитраты, тартраты, лактаты, глутаматы, аспартаты, пикраты, карбонаты и подобные), соли сульфонов, кислот (метансульфонаты, бензолсульфонаты, толуолсульфонаты и т.п.), и подобные соли. Каждая из таких солей может быть получена известными способами.

Соединения, имеющие формулу I, т.е., тиазолидины пиридинового типа, могут быть получены следующими далее способами синтеза.

Растворитель, применяемый при реакции получения соединения, является стабильным в условиях реакции, и, предпочтительно, настолько инертным, чтобы не ингибировать реакцию. Примерами растворителей для реакции являются вода, спирты (такие как метанол, этанол, пропанол, бутанол и октанол), целлозольвы (такие как метоксиэтанол и этоксиэтанол), апротонные полярные органические растворители (такие как диметилформамид, диметилсульфоксид, диметилацетамид, тетраметилмочевина, сульфолан и N,N-диметилимидазолидин), простые эфиры (такие как диэтиловый эфир, диизопропиловый эфир, тетрагидрофуран и диоксан), алифатические углеводороды (такие как пентан, н-гексан, циклогексан, октан, декалин и петролейный эфир), ароматические углеводороды (такие как бензол, хлорбензол, нитробензол, толуол, ксилол и тетралин), галогенсодержащие углеводороды (такие как хлороформ, дихлорметан и дихлорэтан), кетоны (такие как ацетон, метилэтилкетон и метилбутилкетон), низшие эфиры алифатических кислот (такие как метилацетат, этилацетат и метилпропионат), алкоксилалканы (такие как диметоксиэтан и диэтоксизэтан), ацетонитрил и подобные растворители. Эти растворители выбирают произвольно в зависимости от химической активности целевой реакции, и используются, соответственно, по одному или в смесях. В некоторых случаях их применяют как неводные растворители, используя водоотнимающие или осушающие средства. Вышеупомянутые растворители являются просто примерами растворителей, которые могут использоваться в реакциях настоящего изобретения, и настоящее изобретение не ограничивается этими условиями.

Способ 1



В этих формулах R^1 , R^2 , R^3 , R^6 , X^1 , X^2 и Z имеют установленные выше значения, и R^8 представляет собой атом водорода или защитную группу для амидной группы (такую как Тг:тритил).

Соединение, в котором R^4 и R^7 в формуле (I) связаны вместе, т.е. соединение формулы (1-1), может быть получено посредством дегидратации-конденсации соединения формулы (II) и соединения формулы (V). Соединение формулы (V) является хорошо известным соединением, или оно может быть синтезировано способом, описанным в "J. Prakt. Chem.," (vol. 2, p. 253, 1909), "J. Prakt. Chem. (vol. 3, p. 45, 1919)," Chem. Ber.", (vol. 118, p. 774, 1985), и в опубликованном патенте Германии N DE-3045059. Соединение формулы (V), в котором R^8 представляет собой водород, может быть использовано в этой реакции после защиты его основного амидного протона подходящим заместителем (таким как Тг:тритил) хорошо известными способами.

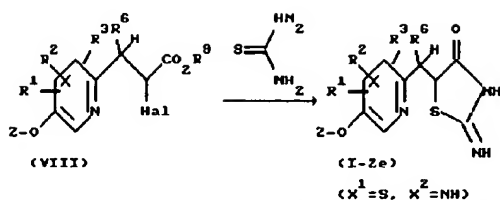
Эту реакцию обычно проводят в подходящем органическом растворителе в присутствии основания или кислоты. Примерами такого растворителя являются спирты, целлозольвы, апротонные полярные органические растворители, простые эфиры, ароматические углеводороды, галогенсодержащие углеводороды, алкоксилалканы и ацетонитрил.

Примерами основания и кислоты являются органические амины (такие как диметиламин, диэтиламин, диизопропиламин, диизопропилэтиламин, триметиламин, триэтиламин, пиперидин, пиперазин, пирролидин, морфолин, пиридин, метаноламин и этаноламин), алкоксиды металлов (такие как метоксид натрия, этоксид натрия и изопропоксид лития), неорганические соли щелочных металлов (такие как карбонат калия, карбонат натрия, гидрокарбонат натрия, гидрокарбонат калия, гидрид натрия, ацетат натрия и ацетат калия), органические кислоты (такие как уксусная кислота, трихлоруксусная кислота и трифторуксусная кислота), неорганические кислоты (такие как фосфорная кислота) и подобные соединения. Эти материалы выбирают, соответственно, в зависимости от активности целевой реакции.

Такая реакция может быть ускорена путем удаления из системы воды, образующейся при реакции, за счет применения соответствующего водоотнимающего агента, такого как молекулярные сита и безводный сульфат натрия, или путем азеотропной перегонки с использованием ловушки Дина-Старка.

Эту реакцию обычно осуществляют при температуре в интервале от 0°C до температуры кипения используемого растворителя, предпочтительно - от 20°C до 120°C, в течение 0,5-30 часов.

Способ 2



В этих формулах R^1, R^2, R^3, R^6 и Z имеют установленные выше значения, R^9 представляет собой (C_1-C_4)-алкил, такой как метил, этил, *n*-пропил, изопропил, *n*-бутил и трет-бутил, и Hal представляет собой атом хлора, атом брома или атом йода.

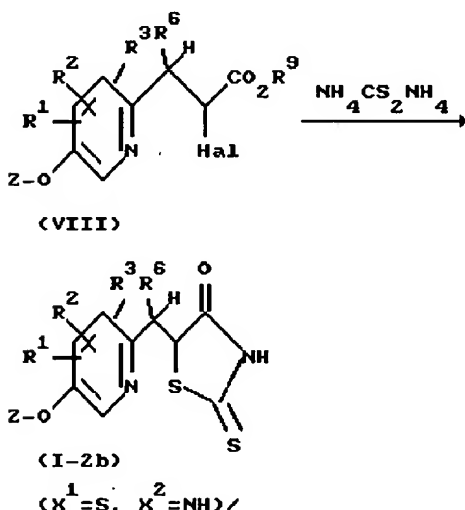
Соединение формулы (1), в котором R^4 и R^7 являются водородами, X^1 представляет собой S , и X^2 представляет собой NH , т.е., соединение формулы (1-2e)/ $R^4, R^7=H, X^1=S, X^2=NH$, может быть получено путем взаимодействия тиомочевины с эфиром галогенкарбоновой кислоты формулы (VIII).

Такую реакцию обычно осуществляют в подходящем органическом растворителе в присутствии основания или кислоты. Примерами используемого растворителя являются спирты, целлозольвы и апротонные полярные органические растворители, и, предпочтительно, используют сульфолан.

Эту реакцию обычно проводят при температуре в интервале от $0^\circ C$ до температуры кипения используемого растворителя, предпочтительно - от $50^\circ C$ до $150^\circ C$, в течение 0,5-10 часов.

Во время реакции образуется галоидоводород как побочный продукт, но для ускорения реакции его можно уловить соответствующим основанием. Примерами применяемого для этого основания являются органические амины (такие как диметиламин, диэтиламин, диизопропиламин, диизопропилэтиламин, триметиламин, триэтиламин, пиперидин, пиперазин, морфолин, пиридин, метаноламин и этаноламин), неорганические соли щелочных металлов (такие как ацетат натрия и ацетат калия, и подобные соединения).

Способ 3



В этих формулах $R^1, R^2, R^3, R^6, R^9, Z$ и Hal имеют установленные выше значения.

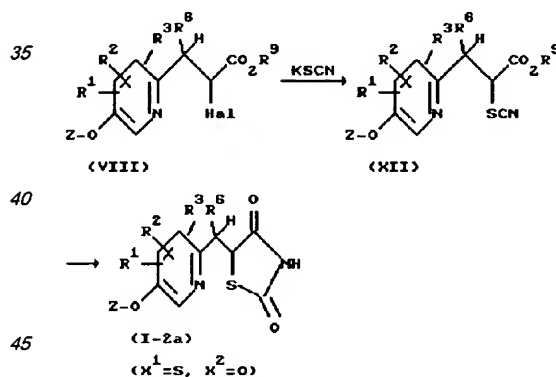
Соединение формулы (I), в котором R^4 и R^7 являются H , и X^1 и X^2 являются S , т.е. соединение формулы (1-2b) ($R^4, R^7=H, X^1, X^2=S$), может быть получено путем взаимодействия дитиокарбамата аммония с эфиром галогенкарбоновой кислоты формулы (VIII).

Такую реакцию обычно проводят в воде, или в подходящем органическом растворителе, или в их смесях. Примерами используемого таким образом растворителя являются спирты, целлозольвы и апротонные полярные органические растворители. Эту реакцию обычно осуществляют при температуре в интервале от $-10^\circ C$ до $50^\circ C$, предпочтительно - от 0° до $30^\circ C$, в течение 0,5-50 часов.

Во время этой реакции в качестве побочного продукта образуется галоидоводород, но для ускорения реакции его можно улавливать подходящим основанием. Примерами применяемого таким образом основания являются органические амины (такие как диметиламин, диэтиламин, диизопропиламин, диизопропилэтиламин, триметиламин, триэтиламин, пиперидин, пиперазин, пирролидин, морфолин, пиридин, метаноламин и этаноламин), неорганические соли щелочных металлов (такие как карбонат калия, карбонат натрия, ацетат натрия и ацетат калия), и т.п.

Полученный таким образом продукт присоединения обрабатывают кислотой (такой как хлористоводородная кислота), и получают соединение формулы (1-2b).

Способ 4



Здесь в формулах $R^1, R^2, R^3, R^6, R^9, Z$ и Hal имеют установленные выше значения.

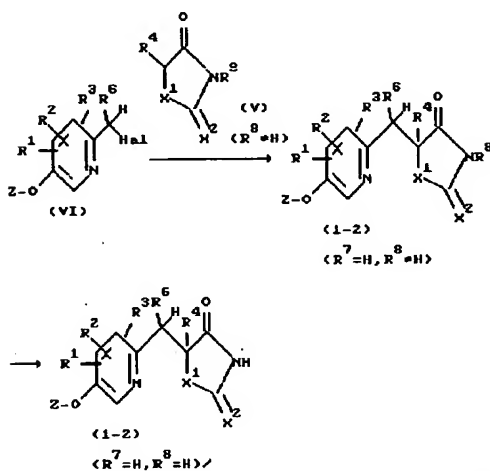
Соединение формулы I, в котором R^4 и R^7 являются H , X^1 представляет собой S , и X^2 представляет собой O , т.е., соединение формулы (I-2a)/ $R^4, R^7=H, X^1=S, X^2=O$, может быть получено путем взаимодействия алкалотиоцианата (такого как тиоцианат калия или тиоцианат натрия) с эфиром галогенкарбоновой кислоты формулы (VIII), с образованием соединения формулы (XII), и обработкой этого соединения кислотой.

Такую реакцию обычно проводят в подходящем органическом растворителе. Примерами применяемого таким образом растворителя являются апротонные полярные органические растворители.

Эту реакцию обычно осуществляют при температуре в интервале от $50^\circ C$ до $150^\circ C$, предпочтительно - от $80^\circ C$ до $120^\circ C$, в течение 0,5-10 часов.

Соединение формулы (XII) выделяют, или его подвергают дальнейшей обработке кислотой в реакционной системе без выделения, и получают целевое соединение формулы (1-2a). Примером применяемой для этого кислоты является хлористоводородная кислота, и обработку кислотой проводят в спирте или в апротонном полярном органическом растворителе. Эту реакцию проводят при температуре от 50°C до 150°C, предпочтительно - от 70°C до 100°C, в течение 5-50 часов.

Способ 5



Здесь в формулах R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^6 , R^8 , X^1 , X^2 , Z и Hal имеют установленные выше значения.

Соединение формулы (I), в котором R^7 представляет собой водород, т.е. соединение формулы (1-2) может быть получено путем взаимодействия соединения формулы (V) с галогенпиридином формулы (VI). Соединение формулы (V), используемое здесь, является хорошо известным соединением, или его можно синтезировать способами, описанными в "Ukr. Khim. Zr." (vol. 16, p. 545, 1950), "J. med. Chem." (vol. 34, p. 1538, 1991), "J. Prakt. Chem." (vol. 2, 79, p. 253 (1909), "J. Prakt. Chem." (vol. 2, 99, p. 56 (1919)), или в публикации не прошедшего экспертизу патента Японии N 216882/1984. Соединение формулы (V), в котором R^8 представляет собой водород, используют в этой реакции, предпочтительно, после защиты его основного амидного протона подходящим заместителем (таким как Tg:третил) известным способом.

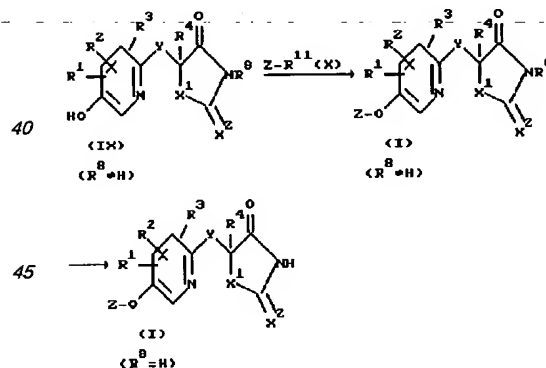
Эту реакцию обычно осуществляют в подходящем органическом растворителе в присутствии основания. Примерами применяемого таким образом растворителя являются апротонные полярные органические растворители, простые эфиры и алкоксиалканы. Примерами применяемого в таком случае основания являются сильные основания, такие как амиды щелочных металлов (например, амид натрия и амид калия). Эти материалы выбирают произвольно, в зависимости от активности целевой реакции.

Кроме того, эту реакцию можно провести в соответствии со способом, описанным в "J. Amer. Chem. Soc." (vol. 87, p. 4588, 1965), или в "J. med. Chem." (vol. 34, p. 1538, 1991). В таком случае соединение формулы

(V) вводится во взаимодействие с метилкарбонатом магния в атмосфере инертного газа, такого как азот, и в протонном полярном органическом растворителе, таком как диметилформамид, с образованием хелатного соединения, и образовавшееся таким образом хелатное соединение затем вводят во взаимодействие с галогенпиридином формулы (VI), и получают соединение формулы (1-2). Эту реакцию обычно проводят при температуре в интервале от 20°C до 150°C, предпочтительно - от 70°C до 100°C. Время реакции изменяется в зависимости от используемых материалов, но образование хелатного соединения занимает от 0,5 до 2 часов, и реакция с галогенпиридином занимает от 0,5 до 5 часов.

В некоторых случаях от амидной группы в положении 3 тиазолидиновой составляющей полученного таким образом соединения формулы (1-2) можно отщепить защитную группу хорошо известным способом. Когда R^8 представляет собой Tg (третил), этот способ осуществляют, используя органическую кислоту, такую как трифторуксусная кислота и трихлоруксусная кислота, или неорганическую кислоту, такую как хлористоводородная кислота и серная кислота. Эту реакцию проводят в отсутствие растворителя или в присутствии растворителя, такого как простые эфиры, включающие тетрагидрофуран и диоксан, и галогенсодержащие растворители, включающие хлороформ и дихлорметан, при температуре в интервале от 0°C до 100°C, предпочтительно - от 10°C до 50°C, в течение 0,1-5 часов.

Способ 6



Здесь в формулах R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^8 , X^1 , X^2 , Y и Z имеют установленные выше значения, и R представляет собой подходящую группу, отщепляющуюся в реакции нуклеофильного замещения, примеры которой включают галоген, такой как хлор, бром и иод, и ароматическую или алифатическую сульфонилоксигруппу, такую как *p*-толуолсульфонилоксигруппа, бензолсульфонилоксигруппа и метансульфонилоксигруппа.

Соединение из числа соединений формулы (I), в котором A представляет собой $COCH_2$ ($m=1$, R^d , $R^e=H$, R^f и R^g вместе представляют собой оксогруппу), может получено при использовании соединения формулы (X), такого как $B-COCH_2-Hal/Z=$ $B-COCH_3$, $R^{11}=Hal$, B и Hal являются заместителями, описанными выше). Такое

соединение является хорошо известным и является доступным коммерчески, или его можно получить хорошо известным способом /например, опубликованный патент Великобритании N 1107677 описывает соединение, в котором В представляет собой пиррол, публикация непрошедшего экспертизу патента Японии N 85372/1986 описывает соединение, в котором В представляет собой оксазол или тиазол, и патент США N 4167626 описывает соединение, в котором В представляет собой триазол). Кроме того, такое соединение может быть получено галогенированием В-СОСН₃ (например, в "Bull. Soc. Chim. Fr. p. 1760 (1973)" описывается соединение, в котором В представляет собой фуран, в "Tetrahedron, 29(2), p. 413 (1973)" описывается соединение, в котором В представляет собой тиофен, в "J. Heterocyclic Chem., 27(5), p. 1209 (1990)" описывается соединение, в котором В представляет собой пиррол, в "Bull. Soc. Chim. Fr. , p. 540 (1988)", "Bull. Soc. Chim. Fr. p. 318 (1987)", "J. Heterocyclic Chem. , 23(1), p. 275 (1986)", "Arch. Pharm., 316(7), p. 608 (1983)" и в "Synlett., (7), p. 483 (1991)" описывается соединение, в котором В представляет собой пирразол, в "J. Heterocyclic Chem., 17(8), p. 1723 (1980)" описывается соединение, в котором В является имидазолом, и в "J. Chem. Soc. C(20), p. 2005 (1976)" и в "Heterocycles, 26(3), p. 745 (1987)" описывается соединение, в котором В представляет собой триазол), как исходного материала, с помощью хорошо известных способов галогенирования (например, способом, описываемым в публикации непрошедшего экспертизу патента Японии N 85372/1986). Кроме того, такое соединение можно получить, подвергая В-СО₂R/R' низший алкил или замещенный или незамещенный бензил (например, "Z. Chem., 9(1), p. 22 (1969)" и "Synth. Commun., 20(16), p. 2537 (1990)" описывают соединения, в котором В представляет собой тиофен, "J. Org. Chem., 55(15), p. 4735 (1990)" и "Chem. Pharm. Bull., 17(3), p. 582 (1969)" описывают соединения, в котором В представляет собой пиррол, публикация выложенного европейского патента N 506194 раскрывает соединение, в котором В представляет собой имидазол, и в "Chem. Ber., 117(3), p. 1194 (1984)" описывается соединение, в котором В представляет собой пирразол или триазол, как исходное вещество, соответствующей хорошо известной реакции восстановления-окисления (например, восстановлению диизобутилалюмогидридом и затем окислению диоксидом марганца), и получают В-СНО, и затем конвертируя полученный таким образом продукт до В-СОСН₂ Hal подходящим способом (например, способом, описанным в "Tetrahedron Letters, p. 4661 (1972)".

Соединение формулы I также можно получить взаимодействием соединения формулы (X) с гидроксильной группой в положении 5 соединения формулы (IX) по реакции нуклеофильного замещения. Соединение формулы (IX) защищают, предпочтительно, путем замещения водорода R⁸ подходящим заместителем (например, Тг:третилом).

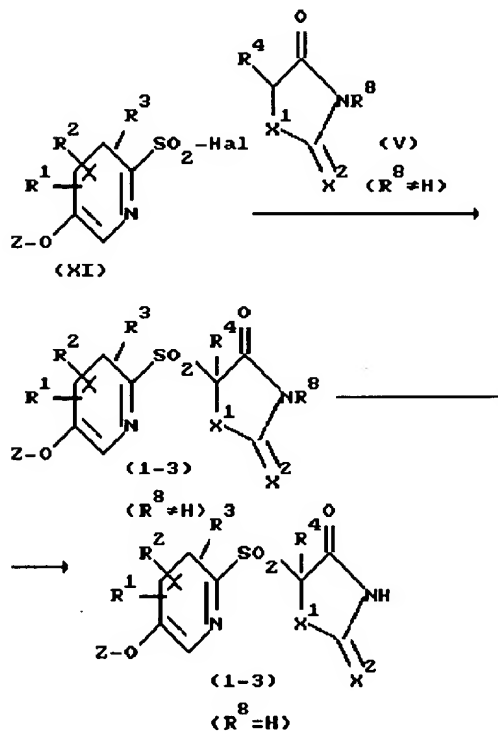
Такую реакцию обычно проводят в подходящем органическом растворителе в присутствии основания. Примерами применяемого растворителя являются апротонные полярные органические растворители, простые эфиры, ароматические углеводороды, гидрированные углеводороды, алкоксиалканы, ацетонитрил и т.п.

Примерами применяемого для этого основания являются органические амины (такие как диметиламин, диэтиламин, диизопропиламин, диизопропилэтиламин, триметиламин, триэтиламин, пиперидин, пиперазин, пирролидин, морфолин, пиридин, метаноламин и этаноламин), алкоксиды металлов (такие как метоксид натрия, этоксид натрия, изопропоксид лития и трет-бутоксид калия), неорганические соли и гидроксиды щелочных металлов (такие как гидроксид натрия, гидроксид калия, гидроксид лития, карбонат калия, карбонат натрия, гидрокарбонат натрия, гидрокарбонат калия, гидрид натрия, ацетат натрия и ацетат калия) и амиды щелочных металлов (такие как амид натрия). Эти материалы выбирают, соответственно, в зависимости от активности целевой реакции.

Эту реакцию обычно осуществляют при температуре в интервале от -20°C до температуры кипения применяемого растворителя, предпочтительно - от 20°C до 150°C, в течение 0,5-30 часов.

От аминогруппы в положении 3 тиазолидина полученного таким образом соединения формулы I можно отщепить защитную группу способом, описанным выше в способе 5.

Способ 7



Здесь в формулах R¹, R², R³, R⁴, R⁸, X¹, X², Z и Hal имеют значения, установленные выше.

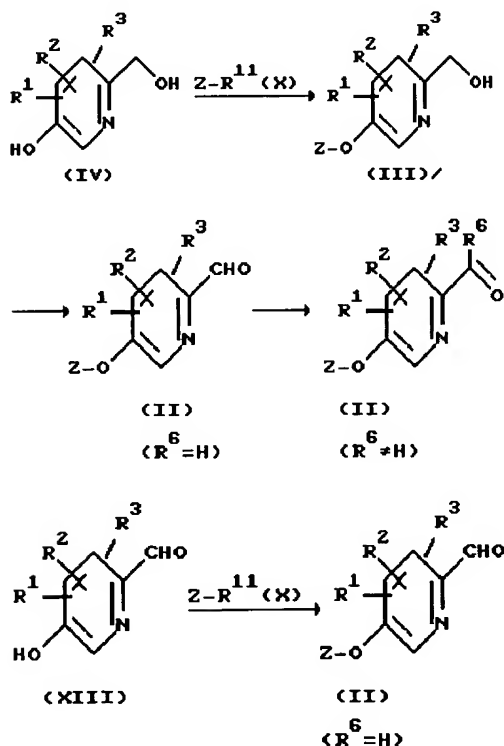
Соединение из числа соединений, имеющих формулу I в котором Y

представляет собой SO₂, т.е. соединение формулы (1-3) (Y=SO₂), может быть получено взаимодействием соединения формулы (V) с соединением формулы (XI). Пиридинсульфонилгалогенид формулы (XI) может быть получен алкилированием гидроксильной группы в положении 5 5-окси-2-пиридинсульфоновой кислоты (как описывается в "J. Chim. Phys. Phys.-Chim. Biol., vol. 79(3), p. 265 (1982)"), как исходного соединения, с помощью соответствующего хорошо известного способа, и затем - галогенированием алкилированного продукта подходящим галогенирующим агентом (например, PCl₅, как описывается в "Org. Synth. Coll., Vol. I, p. 84 (1941)" и "J. Amer. Chem. Soc., vol. 69 p. 1170 (1947)", и SOCl₂/DMФА, как описывается в "Helv. Chim. Acto., vol. 42, p. 1653 (1959)").

Такую реакцию обычно осуществляют в атмосфере инертного газа, такого как азот, в подходящем органическом растворителе в присутствии сильного основания. Примерами применяемого для этой цели растворителя являются простые эфиры, предпочтительно - тетрагидрофуран. Примерами применяемого основания являются амиды щелочных металлов (такие как LDA-диизопропиламид лития), алифатические или ароматические соединения лития (такие как n-бутиллитий, трет-бутиллитий и фениллитий). Эти материалы выбирают соответствующим образом, в зависимости от активности целевой реакции.

Эту реакцию обычно проводят при температуре в интервале от -100°C до 50°C, предпочтительно - от -78°C до 20°C, в течение 0,1-10 часов.

Промежуточные соединения, используемые при синтезе соединений настоящего изобретения, получают так, как показано далее.



Здесь в формулах R¹, R², R³, R⁶, R¹¹ и Z

имеют установленные выше значения.

Соединение из числа соединений, имеющих формулу (II), в котором R⁶ представляет собой водород, может быть получено взаимодействием соединения формулы (X) с гидроксильной группой в положении 5 5-гидроксипиридинметанола формулы (IV) посредством реакции нуклеофильного замещения с образованием соединения формулы (III), и окислением гидроксиметильной группы в положении 2 полученного таким образом соединения формулы (III).

5-Гидроксипиридинметанола формулы (IV) могут быть синтезированы таким способом, какой описан в патенте США N 4202901. При этом способе 2-гидроксипиридинметанол можно получить путем окисления 5-гидрокси-2-пиколина подходящим окислителем (таким как пероксид водорода в уксусной кислоте) с образованием пиридин-N-оксида, переводом пиридин-N-оксида в ацилоксиметилпиридин подходящим ангидридом органической кислоты (таким как уксусный ангидрид) и гидролизом ацилоксиметилпиридина соответствующей кислотой или основанием с образованием 5-гидроксипиридинметанола. Метилзамещенный продукт можно получить таким способом, какой описан в "J. med. Chem., vol. 20(10), p. 1528 (1977)", и в "J. med. Chem., vol. 35(20), p. 3667 (1992)", гидроксизамещенный продукт может быть получен таким способом, какой описан в "Bull. Sci. Jpn. vol. 52(1), p. 107 (1979)", и бром- или хлорзамещенный продукт может быть получен таким способом, какой описан в патенте США N 4025333 и в "J. med. Chem., vol. 17 (2), p. HS (1974)".

Стадия получения соединения формулы (III) может быть проведена при тех же условиях, какие описаны при рассмотрении способа 6:

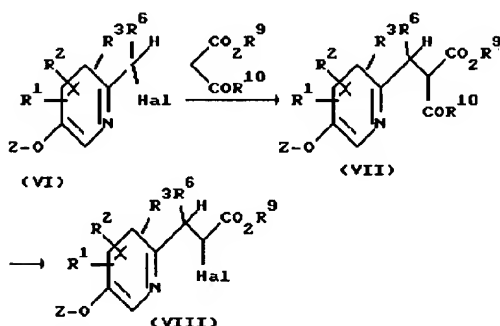
Стадия получения соединения формулы (II) может быть осуществлена при применении подходящего окислителя (такого как диоксид марганца, PCC-хлорхромат пиридиния, PDC-дихромат пиридиния, DDQ - дихлордифенилбензохинон, хлорант, окислитель Сверна (Swern) - оксалилхлорид-диметилсульфоксид-третичный амин, и комплекс триоксида серы с пиридином).

Соединение формулы (II) также может быть получено взаимодействием соединения формулы (X) с гидроксильной группой в положении 5 гидроксипиридинальдегида формулы (XIII) по реакции нуклеофильного замещения. Гидроксипиридинальдегид формулы (XIII) может быть получен таким способом, какой описан в публикации не прошедшего экспертизы патента Японии N 273659/1990, или путем окисления гидроксиметильной группы соединения формулы (IV) подходящим известным окислителем, таким как PCC (хлорхромат пиридиния). Стадия получения соединения формулы (II) проводится путем взаимодействия вещества в подходящем органическом растворителе или в присутствии основания. Примерами применяемых для этой цели растворителей являются апротонные полярные органические растворители, простые эфиры, ароматические углеводороды,

галоидсодержащие углеводороды, алкоксиалканы и ацетонитрил, и среди этих растворителей предпочтительным для применения является диметилформамид (ДМФА). Примерами применяемого основания являются органические амины (такие как диметиламин, диэтиламин, пиперидин, пиперазин, пирролидин, морфолин, пиридин, метаноламин, этаноламин, улавливатель кислоты Н:- 3,4-дигидро-2Н-пиридо [1,2-а] пиримидин-2-он, и улавливатель кислоты 9М:-9-метил-3,4-дигидро-2Н-пиридо[1,2-а] пиримидин-2-он) и неорганические гидриды, гидроксиды и соли щелочных металлов (такие как гидроксид натрия, гидрокарбонат натрия, гидрокарбонат калия, гидрид натрия, ацетат натрия и ацетат калия), и среди этих соединений предпочтительными для применения являются диизопропилэтиламин, улавливатель кислоты 9М и гидрокарбонат натрия. Эти материалы выбираются соответствующим образом, в зависимости от активности целевой реакции. Эту реакцию обычно проводят при температуре в интервале от -10°C до 100°C, предпочтительно - от 0°C до 50°C, в течение 0,5-5 часов.

Соединение формулы (II) ($R^6=H$), полученное вышеупомянутым способом, затем может быть модифицировано в соединение формулы (II) ($R^6 \neq H$) путем алкилирования формильной группы подходящим алкилирующим агентом по хорошо известному способу.

Эта стадия может проводиться по способу с использованием диазметана, как описано в "Tetrahedron Letters, p.955 (1963)", и в "Chem. Ber., vol. 40, p. 479 (1907)", по способу с использованием галогенсодержащего алкила, как описано в "Synth. Commun. vol. 14(8), p.743 (1984)", или по способу с использованием алкиллития, как описано в "J. Org. Chem. vol. 30, p. 226 (1965)".



Здесь в формулах $R^1, R^2, R^3, R^6, R^9, Z$ и $Ha1$ имеют установленные выше значения, и R^{10} представляет собой OR^9/R^9 имеет установленные выше значения/ или (C_1-C_3) -алкил, такой как метил, этил, н-пропил и изопропил.

Сложный эфир галогенсодержащей карбоновой кислоты формулы (VIII) может быть получен взаимодействием галогенметилпиридина с эфиром малоновой кислоты или с низшим эфиром ацилуксусной кислоты по известным способам с образованием соединения формулы (VII), и путем галогенирования полученного таким образом соединения.

Галогенметилпиридин формулы (VI) может быть синтезирован таким способом, какой

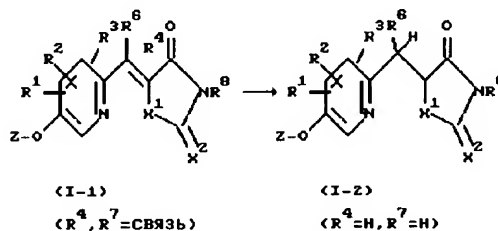
описан в "Bull. Pol. Acad. Sci. Chem. vol. 1-12, p. 17 (1990)". Таким образом, галогенметилметилпиридин формулы (VI) может быть получен галогенированием ацилуксусметилпиридина, описанным при синтезе соединений формулы (III) или (IV), подходящим галогенирующим агентом (таким как тионилгалогенид, оксигалогенид фосфора, тригалогенид фосфора, пентагалогенид фосфора, хлористоводородная кислота и бромистоводородная кислота). Оно может быть также получено галогенированием пиридин-N-оксида, как исходного вещества, оксигалогенидом фосфора, бензолсульфонилгалогенидом или п-толуолсульфонилгалогенидом, по способу, какой описан в патенте США N 5202321, "J. Org. Chem. vol. 27, p. 3856 (1962)", или в "J. Org. Chem., vol. 38, p.927 (1975)".

Соединение из числа соединений, имеющих формулы (VII), в котором R^{10} представляет собой (C_1-C_3) -алкил, может быть получено взаимодействием галогенметилпиридина формулы (VI) с низшим эфиром ацилуксусной кислоты, таким как метилацетоацетат и этилацетоацетат, в присутствии подходящего основания (такого как гидроксид натрия, гидроксид калия, метоксид натрия, этоксид натрия, амид натрия, амид калия, диизопропиламид, бутиллитий, металлический натрий и карбонат калия), по способу, какой описан в "J. Amer. Chem. Soc., vol. 64, p.435 (1942)".

Соединение из числа соединений, имеющих формулу (VII), в котором R^{10} представляет собой OR^9 , может быть получено взаимодействием галогенметилпиридина формулы (I) с эфиром малоновой кислоты, таким как диэтилмалонат и ди-трет-бутилмалонат, в присутствии подходящего основания, какое упоминалось выше, по такому способу, какой описан в "J. Amer. Chem. Soc., vol. 74, p. 831 (1952)", и в "Org. Synth. Coll., vol. 3, p.705 (1955)".

Стадия синтеза соединения формулы (VIII) может проводиться при использовании подходящего агента галогенирования (такого как бром и N-хлорсукцинимид) в присутствии подходящего основания (такого как гидроксид натрия, метоксид натрия и карбонат калия) по такому способу, какой описан в "J. Amer. Chem. Soc., vol. 71, p. 3107 (1949)", и в "Tetrahedron Letters. vol. 28, p. 5505 (1987)".

Соединение формулы (VIII) может быть также получено взаимодействием галогенметилпиридина формулы (VI) с диазоуксусным эфиром в присутствии медного катализатора по такому способу, какой описан в "Zur. Russ. Fiz-Chim., vol. 21, p. 851 (1951)".



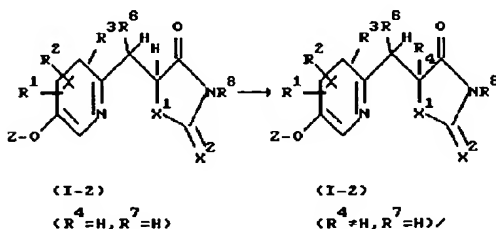
Здесь в формулах $R^1, R^2, R^3, R^6, R^8, R^9, X^1$ и Z имеют установленные выше значения.

Соединение формулы (1-1) (в котором R^4 и R^7 вместе являются связью),

полученное вышеописанным способом, может быть модифицировано в соединение формулы (1-2) (R^4 , $R^7=H$) путем соответствующего восстановления двойной связи между пиридиновым кольцом и тиазолидиновым кольцом (например, путем каталитического гидрирования в присутствии подходящего катализатора, путем использования подходящего комплексного металлводородного соединения или путем использования амальгамы магния или натрия в метаноле).

Каталитическое гидрирование обычно проводят в спиртах, целлозольвах, апротонных полярных органических растворителях, простых эфирах, алкоксиалканах, низших эфирах алифатических кислот или в низших алифатических кислотах, и предпочтительно использовать, в частности, метанол, этанол, метоксиэтанол, ди-метилформамид, тетрагидрофуран, диоксан, диметоксиэтан, этил-ацетат или уксусную кислоту, в качестве единственного растворителя или в смеси. Примерами применяемых катализаторов являются палладиевая чернь, палладий-на-угле и оксид платины. Эта реакция может протекать при нормальной температуре и при нормальном давлении, но предпочтительно проводить реакцию при повышенной температуре и при повышенном давлении, в зависимости от активности целевой реакции.

Восстановление металлводородным комплексом проводят, используя борогидрид натрия, борогидрид калия, борогидрид лития, борогидрид тетраметиламмония или борогидрид цинка в апротонном полярном органическом растворителе при температуре в интервале от 0°C до 150°C , предпочтительно - от 0°C до 30°C . При таком восстановлении нежелательные побочные реакции можно подавить, используя кобальтовые реагенты, такие как CoCl_2 , CoCl_3 или $\text{Co}(\text{OAc})_2$, в присутствии лиганда, такого как диметилглиоксим, 2,2'-бипиридин или 1,10-фенантролин (см. ВОИС 93/13095).



Здесь

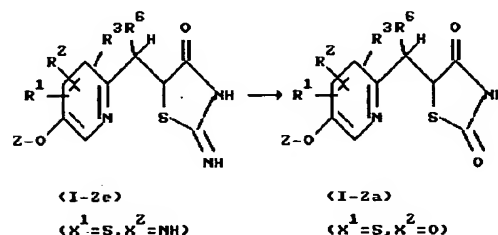
$R^1, R^2, R^3, R^4, R^6, R^8, X^1, X^2$ и Z имеют установленные выше значения.

Соединение формулы (1-2) ($R^4, R^7=H$) может быть модифицировано в соединение формулы (1-2) ($R^4 \neq H, R^7=H$) путем алкилирования в положении 5 тиазолидина подходящим алкилирующим агентом (таким как галогенсодержащий алкил, включая метилиодид или этилиодид, алкилсульфат, включая диметилсульфат или диэтилсульфат, и эфиры алифатических или ароматических сульфоновых кислот, такие как метилтозилат или метилмезилат) в соответствии с хорошо известными способами.

Такую реакцию обычно осуществляют в подходящем органическом растворителе в

присутствии основания. Примерами применяемых для этого растворителей являются апротонные полярные органические растворители, простые эфиры, алкоксиалканы и подобные растворители, и среди этих растворителей особенно предпочтительными являются тетрагидрофуран и диметоксиэтан. Примеры основания включают амиды щелочных металлов (такие как диизопропиламид лития (LDA) и амид калия) и алифатические или ароматические соединения лития (такие как *n*-бутиллитий, трет-бутиллитий и фениллитий). Эти материалы выбирают соответствующим образом в зависимости от активности целевой реакции.

Такую реакцию обычно осуществляют при температуре в интервале от -20°C до 100°C , предпочтительно - от -10°C до 30°C , в течение 0,1-10 часов.



Здесь

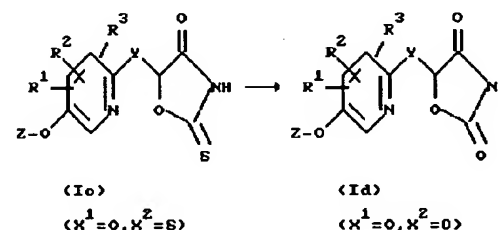
R^1, R^2, R^3, R^6 и Z имеют установленные

выше

Соединение формулы (I-2e) $X^1=S, X^2=NH$ может быть модифицировано в соединение формулы (I-2a) $X^1=S, X^2=O$ путем гидролиза иминогруппы в положении 2 тиазолидина в соответствии с известными способами.

Эту реакцию обычно осуществляют в подходящем органическом растворителе в присутствии воды или кислоты. Примерами применяемых в таком случае растворителей являются спирты, целлозольвы, апротонные полярные органические растворители, простые эфиры, алкоксиалканы и т.п., и особенно предпочтительно использовать метанол, этанол, метоксиэтанол, сульфолан, диоксан и диметоксиэтан. Примерами применяемой в таком случае кислоты являются неорганические кислоты (такие как хлористоводородная кислота, серная кислота и бромистоводородная кислота). Эти материалы выбирают соответствующим образом, в зависимости от активности целевой реакции.

Упомянутую реакцию обычно проводят при температуре от 50°C до температуры кипения используемого растворителя, предпочтительно - от 80°C до 150°C , в течение 0,5-30 часов.



Здесь

R^1, R^2, R^3, Y и Z имеют вышеустановленные значения.

Соединение формулы (1с) ($X^1=O$, $X^2=S$) может быть модифицировано в соединение формулы (1d) ($X^1=O$, $X^2=O$) путем окисления тиоксогруппы в положении 2 тиазолидина в соответствии с хорошо известными способами.

Такая реакция проводится с использованием подходящего окислителя (такого как пероксид водорода, органический пероксид, в том числе, перуксусная кислота, пербензойная кислота, метаклорпербензойная кислота, монопермалеиновая кислота, моноперфталевая кислота и подобные кислоты, ион ртути, бром, хлор и метапериодная кислота), как правило, в воде или в растворителе, таком как полярные апротонные растворители (например, диметилформамид, диметилсульфоксид, диметилацетамид, тетраметилмочевина, сульфолан, и N, N-диметилимидазолидинон), простые эфиры (например, тетрагидрофуран и диоксан) и алкоксиалканы (например, диметоксиэтан и диэтоксиэтан). Эти материалы выбирают, соответственно, в зависимости от активности целевой реакции, и используют, соответственно, по одному или в сочетании.

Эту реакцию обычно проводят при температуре в интервале от 0°C до температуры кипения используемого растворителя, предпочтительно - от 20°C до 100°C, в течение 0,5-30 часов.

Соединение формулы (I) может быть превращено в форму соответствующего N-оксида путем окисления атома азота на пиридиновом кольце подходящим окислителем в соответствии с хорошо известным способом. Примерами окислителя, применяемого при этом способе, являются пероксид водорода (применяют в уксусной кислоте или трифторуксусной кислоте при температуре от 0°C до 100°C, предпочтительно - от 50°C до 80°C, в течение 1-20 часов, предпочтительно - от 3 до 10 часов, необязательно, в присутствии каталитического количества серной кислоты для ускорения реакции), перуксусная кислота (используют в воде или уксусной кислоте, необязательно, в органическом растворителе, таком как тетрагидрофуран или этилацетат, при температуре от 0°C до 100°C, предпочтительно - от 40°C до 80°C, в течение 1-10 часов, предпочтительно - 3-5 часов), пербензойная кислота или метаклорпербензойная кислота (используют в органическом растворителе, таком как хлороформ или бензол, при температуре от 0°C до 50°C, предпочтительно - от 10°C до 30°C, в течение 0,1-3 часов, необязательно, более 2 недель), и монопермалеиновая кислота или моноперфталевая кислота (с ними работают в органическом растворителе, таком как хлороформ или этанол, при температуре от -10°C до 50°C, предпочтительно - от 0°C до 30°C, в течение 0,5-50 часов, предпочтительно - от 1 до 10 часов). Такие окислители могут применяться в сочетании. Такие N-оксидные продукты также могут быть превращены в соответствующие соединения пиридина посредством восстановления атома

азота на пиридиновом кольце подходящим восстановителем в соответствии с хорошо известным способом. Примерами восстановителя, применяемого при таком способе, являются водород в каталитическом гидрировании (работают в органическом растворителе, таком как уксусная кислота, уксусный ангидрид, метанол или этанол, необязательно, в их смесях, при температуре от 0°C до 100°C, предпочтительно - от 10°C до 70°C, при давлении от атмосферного до 30 атм, предпочтительно - от нормального давления до 10 атм, в присутствии катализатора, такого как никель Ренея, никель Urushibara, палладий-на-угле или оксид платины), железо (работают в уксусной кислоте при температуре от 50°C до 100°C, предпочтительно - от 70°C до 80°C, в течение 0,5-5 часов, предпочтительно - от 1 до 2 часов), цинк (работают в уксусной кислоте, необязательно, в присутствии каталитического количества серной кислоты), трихлорид фосфора, пентахлорид фосфора и трибромид фосфора (работают в органическом растворителе, таком как хлороформ или этилацетат, при температуре от 0°C до 100°C, предпочтительно - от 20°C до 80°C, в течение 0,5-5 часов, предпочтительно - от 1 до 3 часов), триэтилфосфин, трифенилфосфин и триэтилфосфит (работают в органическом растворителе, таком как этилацетат, при температуре от 150°C до 300°C, в течение 0,5-10 часов), и сера и диоксид серы (работают в органическом растворителе, таком как бензол или хлорбензол, при температуре от 150°C до 200°C, в течение 0,5-30 часов).

Вышеупомянутые соединения (II), (III), (IV), (VI), (VII), (VIII), (IX) и (X) являются новыми соединениями, и пригодны в качестве промежуточных продуктов для получения соединения формулы (I) настоящего изобретения.

В табл. 1-16 приводятся примеры соединений, имеющих формулы (1-1), (1-2) и (1-3) настоящего изобретения. Кроме того, пиридин-N-оксиды, полученные окислением атома азота на пиридиновом кольце, и соли, образованные при обработке азота основания на тиазолидиновом кольце хорошо известным способом, также являются соединениями настоящего изобретения.

Как видно из следующих далее результатов испытаний, соединения (I) или их фармацевтически приемлемые соли настоящего изобретения обладают гипогликемической активностью и могут использоваться одни или в смесях с известными фармацевтически приемлемыми связующими, эксципиентами, смазками или дезинтеграторами для предупреждения или лечения сахарного диабета у млекопитающих, в том числе у человека, мышей, крыс, кроликов, собак, обезьян, коров, лошадей, свиней и т.п. Соединения (I) или их фармацевтически приемлемые соли настоящего изобретения также могут применяться в сочетании с различными оральными гипогликемическими средствами, такими как производные инсулина, производные сульфонилмочевины и производные бигуанидина, и с ингибиторами альдозоредуктазы.

Кроме того, как очевидно из следующих далее результатов испытаний, соединения (I) или их фармацевтически приемлемые соли настоящего изобретения обладают антигликационной активностью и свойствами ингибирования альдозоредуктазы, и, следовательно, являются пригодными для предупреждения или лечения диабетических осложнений, включая диабетические глазные болезни (диабетическая катаракта, диабетическая ретинопатия и т.д.), диабетическую нефропатию, диабетическую нефропатию, диабетическую гангрену, и т.п.

Соединения (I) настоящего изобретения могут быть включены в различные подходящие составы в зависимости от способа введения. Соединения настоящего изобретения могут вводиться в форме свободного тиазолидиндиона или в форме гидролизуемых в организме и фармацевтически приемлемых солей (таких как натриевые соли или калиевые соли).

Фармацевтическую композицию настоящего изобретения вводят предпочтительно перорально в форме самого соединения настоящего изобретения или в форме порошков, гранул, таблеток или капсул, составленных путем смешения соединения настоящего изобретения с подходящим фармацевтически приемлемым носителем (таким как гидроксипропилцеллюлоза, сироп, аравийская камедь, желатин, сорбит, трагакантовая смола, поливинилпирролидон или СМС-Са), эксципиентом (таким как лактоза, сахар, кукурузный крахмал, фосфат кальция, сорбит, глицин или микрокристаллическая целлюлоза), смазкой (такой как стеарат магния, тальк, полиэтиленгликоль или диоксид кремния) и разрыхлителем (таким как картофельный крахмал).

Однако, фармацевтическая композиция настоящего изобретения не ограничивается предназначением для перорального введения, и является приемлемой для парентерального введения. Например, ее можно вводить в форме, например, суппозитория, составленного с использованием масляной основы, такой как масло какао, полиэтиленгликоль, ланолин или триглицерид жирной кислоты, в форме трансдермальной лечебной мази, приготовленной с применением медицинского парафинового масла, белого вазелина, высшего спирта, мази Macrogol, гидрофильной мази или материала на основе гидрогеля, в форме состава для инъекций, приготовленного с использованием одного или нескольких веществ, выбираемых из группы, состоящей из полиэтиленгликоля, основы - гидрогеля, дистиллированной воды, для инъекций и эксципиента, такого как лактоза или кукурузный крахмал, или в форме состава для введения через слизистые оболочки, такие как глазная слизистая оболочка, назальная слизистая и ротовая слизистая оболочка.

Суточная доза соединения настоящего изобретения составляет 0,05-50 мг, предпочтительно - от 0,1 до 10 мг, на кг массы тела пациента, и ее вводят за один-три раза в сутки. Доза, конечно, может изменяться в зависимости от возраста, массы или стадии заболевания пациента.

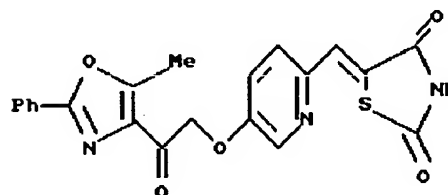
Теперь настоящее изобретение будет

описываться подробнее с помощью тестовых примеров, оценивающих фармакологическую активность соединений настоящего изобретения, примеров получения соединений и примеров приготовления составов. Однако, следует иметь в виду, что настоящее изобретение не ограничивается такими конкретными примерами.

Пример 1

Получение

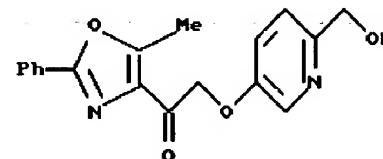
5-((5-(2-оксо-2-(2-фенил-5-метил-4-оксазолил)этокси)-2-пиридил)метилиден) тиазолидин-2,4-диона (соединение N I-1a-1)



Стадия 1

Получение

5-(2-оксо-2-(2-фенил-5-метил-4-оксазолил)этокси) 2- пиридинметанола (соединение N 111-1)



В 100 мл диметилформамида, обезвоженного молекулярным ситом, растворяют 4,04 г (25 ммоль) 5-гидроксипиридинметанола гидрохлорида (соединение N IV-I) (полученного по способу, описанному в патенте США N 4202901) и 7,00 г (25 ммоль)

4-бромацетил-5-метил-2-фенилоксазола (полученного из

4-ацетил-5-метил-2-фенилоксазола по способу, описанному в " J. Chem. Soc., (C), p. 1397 (1968), и в публикации не прошедшего экспертизу патента Японии N 85372 (1986)). К полученному в результате раствору добавляют 5,18 г безводного карбоната калия и полученный раствор перемешивают при комнатной температуре в течение 4 часов. Из этого реакционного раствора с помощью испарителя при 60°C и пониженном давлении отгоняют растворитель, и полученный таким образом вязкий остаток экстрагируют 100 мл хлороформа. Полученный таким образом раствор промывают солевым раствором и сушат над безводным сульфатом магния. После удаления фильтрацией осушающего агента остаток, образовавшийся при отгонке растворителя при пониженном давлении, подвергают колоночной хроматографии на силикагеле (элюент 50% этилацетата в бензоле, затем этилацетат, и в конце - 5% метанола в хлороформе), и получают 2,58 г (31,9%) желто-коричневого порошка целевого продукта (соединение N III-1). Т.пл. 133-134 °C.

М.-с. (FAB) m/e: 325(M+H)⁺

¹H ЯМР (CDCl₃) δ : 2,74(3H, c), 3,5 (1H), 4,74 (2H, c), 5,44 (2H, c), 7,3-7,4 (2H, м), 7,48-7,51 (3H, м), 8,04-8,06 (2H, м), 8,34-8,35 (1H, м).

Такую же операцию, какая описана выше, осуществляя, используя в качестве

исходного материала Z-галогенированные вещества, проводят ее в диметилформамиде или в хлороформе в присутствии основания, такого как гидрид натрия или триэтиламин, и получают соединения NN (III-2)-(III-5). (Таблица к стадии 1 примера 1 приведена в конце описания, где Z соответствует заместителям в соединении формулы III).

III-2 ^1H -ЯМР (CDCl_3) δ : 3,45 (3H, c), 4,2 (1H), 4,65 (2H, c), 5,15 (2H, c), 7,2-7,4 (2H, м), 8,2-8,3 (1H, м).

III-3 ^1H -ЯМР (CDCl_3) δ : 3,3 (1H, c), 4,65 (2H, c), 5,15 (2H, c), 7,1-7,3 (2H, м), 7,3-7,5 (5H, м), 8,2-8,3 (1H, м).

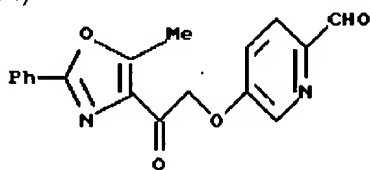
III-4 ^1H -ЯМР (CDCl_3) δ : 3,7 (1H), 4,75 (2H, c), 7,1-8,5 (8H, м).

III-5 ^1H -ЯМР (CDCl_3) δ : 1,1 (9H, c), 4,5 (2H, c), 6,9-8,2 (13H, м).

Стадия 2

Получение

5-(2-оксо-2-(2-фенил-5-метил-4-оксазолил)этокси) 2-пиридинкарбальдегида (соединение N-II-1)



В 5 мл обезвоженного хлороформа растворяют 0,15 г (0,47 ммоль) соединения N III-1. К этому раствору добавляют 340 мг активного диоксида марганца, и полученный в результате раствор перемешивают при комнатной температуре в течение 5 суток. После определения исчезновения исходного вещества по данным тонкослойной хроматографии остаток окислителя удаляют фильтрацией. Полученный таким образом раствор обрабатывают активированным углем и отгоняют растворитель при пониженном давлении. Получают 0,11 г (72,8% целевого продукта в виде коричневого порошка (соединение N II-1).

Т.пл. 115-118°C. М.-С (FAB) m/e: 323 (M+H)⁺.

^1H ЯМР (CDCl_3) δ : 2,74 (3H, c), 5,54 (2H, c), 7,36-7,38 (1H, м), 7,49-7,52 (3H, м), 7,97-7,99 (1H, м), 8,0-8,1 (1H, м), 8,53-8,54 (1H, м), 10,04 (1H, c).

Таким же способом, какой описан выше, получают соединения NN (II-2)-(II-5). (Таблица к стадии 2 примера 1 приведена в конце описания, где Z соответствует заместителям в соединении формулы II).

II-2 ^1H -ЯМР (CDCl_3) δ : 3,48 (3H, c), 5,25 (2H, c), 7,3-7,6 (1H, м), 7,8-8,0 (1H, м), 8,4-8,5 (1H, м), 9,90 (1H, c).

II-3 ^1H -ЯМР (CDCl_3) δ : 5,17 (2H, c), 7,3-7,5 (6H, м), 7,8- 8,1 (1H, м), 8,4-8,5 (1H, м), 9,90 (1H, c).

II-4 ^1H ЯМР (CDCl_3) δ : 7,2-8,3 (7H, м), 8,6-8,8 (1H, м), 9,97 (1H, c).

В 29 мл диметилформамида, обезвоженного молекулярными ситами, растворяют 0,756 г (6,14 ммоль) 5-гидрокси-2-пиридин-карбальдегида (соединение N XIII-1) (полученное по способу, описанному в публикации не прошедшего экспертизу патента Японии N 273659(1990) и 1,72 г (6,14 ммоль) 4-бромацетил-5-метил-2-фенилоксазола, и

полученный в результате раствор перемешивают при комнатной температуре. К этому раствору постепенно добавляют 1,6 мл (9,21 ммоль) диизопропилэтиламина, и полученный в результате раствор перемешивают при комнатной температуре в течение 2,5 часов. После определения тонкослойной хроматографией окончания реакции к полученному в результате раствору добавляют 200 мл хлороформа и полученный раствор промывают солевым раствором. Органический слой сушат над безводным сульфатом натрия. После удаления фильтрацией осушающего агента при пониженном давлении отгоняют растворитель. Полученные таким образом остаток подвергают колоночной хроматографии на силикагеле (50% этилацетата в гексане), и получают 1,318 г (61%) целевого продукта (соединение N II-1).

Таким же способом, какой описан выше, получают соединения NN (II-6)-(II-18). (Эти соединения описаны в таблице, приведенной в конце описания, где Z соответствует заместителям в соединении формулы II).

II-6

^1H ЯМР (CDCl_3) δ : 2,35 (3H, c), 2,61 (3H, c), 5,38 (2H, c), 7,16 (3H, м), 7,80 (3H, м), 8,40 (1H, м), 9,86 (1H, c).

II-7

^1H ЯМР (CDCl_3) δ : 2,42 (3H, c), 2,68 (3H, c), 5,48 (2H, c), 7,33 (3H, м), 7,90 (3H, м), 8,50 (1H, м), 9,96 (1H, c).

II-8

^1H ЯМР (CDCl_3) δ : 2,68 (3H, c), 5,44 (2H, c), 6,86 (1H, м), 7,55 (1H, м), 7,87 (1H, м), 8,05 (2H, м), 8,51 (1H, м), 9,99 (1H, c).

II-9

^1H ЯМР (CDCl_3) δ : 2,74 (3H, c), 5,51 (2H, c), 7,1-8,5 (12H, м), 10,03 (1H, c).

II-10

^1H ЯМР (CDCl_3) δ : 2,68 (3H, c), 5,46 (2H, c), 7,24 (3H, м), 7,95 (3H, м), 8,5 (1H, м), 10,03 (1H, c).

II-11

^1H ЯМР (CDCl_3) δ : 2,83 (3H, c), 5,52 (2H, c), 7,35 (3H, м), 7,85 (5H, м), 8,50 (2H, м), 9,97 (1H, c).

II-12

^1H ЯМР (CDCl_3) δ : 2,70 (3H, c), 5,49 (2H, c), 7,40 (2H, м), 7,93 (4H, м), 8,45 (1H, м), 9,96 (1H, c).

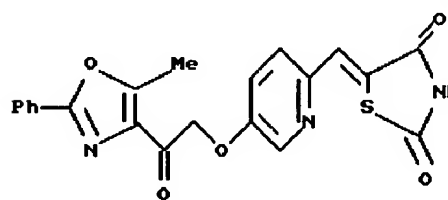
II-13

^1H ЯМР (CDCl_3) δ : 2,70 (3H, c), 3,88 (3H, c), 5,51 (2H, c), 6,99 (2H, м), 7,35 (1H, м), 7,97 (3H, м), 8,51 (1H, м), 10,0 (1H, c).

Стадия 3

Получение

5-((5-(2-оксо-2-(2-фенил-5-метил-4-оксазолил)этокси)-2-пиридил)метилен)тиазолидин-2,4-диона (соединение N I-1a-1)



В 10 мл толуола, обезвоженного молекулярным ситом, суспендируют 0,15 г (0,47 ммоль) соединения N (II-1) и 0,11 г

тиазолидиндиона. К этому раствору добавляют 8,4 мг ледяной уксусной кислоты и затем 7,9 мг пиперидина, и полученный в результате раствор перемешивают при 130 °С в течение 15 часов. После определения по данным тонкослойной хроматографии исчезновения исходных веществ выпавшее в осадок вещество растворяют, добавляя к реакционной смеси хлороформ и метанол. Полученный таким образом раствор промывают рассолом и сушат над безводным сульфатом магния. После удаления фильтрацией осушающего агента удаляют растворитель при пониженном давлении и полученный таким образом остаток подвергают колоночной хроматографии на силикагеле (элюент хлороформ, и затем 5% метанола в хлороформе). Получают 0,18 г (94,1%) целевого продукта в виде бледно-коричневого порошка (соединение N 1-1a-1).

Т. пл. 229-231 °С.

М.-с. (FAB) m/e: 422 (M+H)⁺

¹H ЯМР (d⁶-ДМСО) δ : 2,69 (3H, с), 5,65 (2H, с), 7,5-7,6 (4H, м), 7,78-7,81 (2H, м), 7,9-8,0 (2H, м), 8,49-8,52 (1H, м), 12,3 (1H, шир. с).

Таким же способом, какой описан выше, получают соединения NN (1-1a-2)-(1-1a-32). (Таблица к стадии 3 примера 1 приведена в конце описания, где Z соответствует заместителям в соединении формулы 1-1a).

1-1a-1

¹H ЯМР (d⁶-ДМСО) δ : 3,14 (3H, с), 5,34 (2H, с), 7,5-7,6 (1H, м), 7,77-7,83 (2H, м), 8,51-8,52 (1H, м), 12,3 (1H).

1-1a-3

¹H ЯМР (d⁶-ДМСО) δ : 5,27 (2H, с), 7,34-7,49 (5H, м), 7,59-7,61 (1H, м), 7,78-7,84 (2H, м), 8,54-8,55 (1H, м), 12,3 (1H); (см. соединения по примерам с 1-1a-6 по 1-1a-32 в конце описания).

1-1a-6

¹H ЯМР (ДМСО, 500 МГц) δ : 2,40 (3H, с), 2,68 (3H, с), 5,65 (2H, с), 7,40 (2H, м), 7,55 (1H, м), 7,80 (2H, м), 7,93 (2H, м), 8,52 (1H, м).

1-1a-7

¹H ЯМР (CDCl₃, 500 МГц) δ : 2,46 (3H, с), 2,75 (3H, с), 5,52 (2H, с), 7,35 (3H, м), 7,55 (2H, м), 7,70 (1H, с), 7,88 (2H, м), 8,55 (1H, с).

1-1a-8

¹H ЯМР (CDCl₃, 500 МГц) δ : 2,70 (3H, с), 5,45 (2H, с), 6,88 (1H, м), 7,46 (1H, м), 7,54 (1H, м), 7,72 (1H, м), 8,06 (2H, м), 8,52 (1H, м).

1-1a-9

¹H ЯМР (CDCl₃, 500 МГц) δ : 2,76 (3H, с), 5,52 (2H, с), 7,45 (5H, м), 7,75 (4H, м), 8,15 (3H, м), 8,65 (1H, м).

1-1a-10

¹H ЯМР (CDCl₃, 500 МГц) δ : 2,74 (3H, с), 5,49 (2H, с), 7,21 (2H, м), 7,29 (1H, м), 7,46 (1H, м), 7,72 (1H, м), 8,05 (2H, м), 8,52 (1H, м), 9,4 (1H шс).

1-1a-11

¹H ЯМР (CDCl₃, 500 МГц) δ : 2,79 (3H, с), 5,55 (2H, м), 7,2-7,5 (3H, м), 7,56 (1H, м), 7,90 (4H, м), 8,15 (1H, м), 8,55 (2H, м).

1-1a-12

¹H ЯМР (CDCl₃, 500 МГц): δ 2,74 (3H,

с), 5,49 (2H, с), 7,16 (1H, м), 7,48 (3H, м), 7,71 (1H, м), 8,00 (2H, м), 8,52 (1H, м).

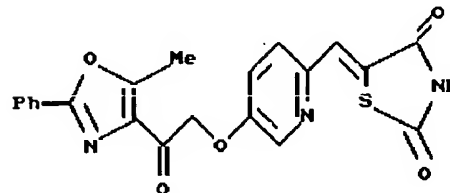
1-1a-13

¹H ЯМР (CDCl₃, 500 МГц) δ : 2,72 (3H, с), 3,88 (3H, с), 5,49 (2H, с), 6,70 (2H, м), 7,15 (1H, м), 7,25 (1H, м), 7,35 (1H, м), 8,00 (2H, м), 8,35 (1H, с).

Пример 2

Получение

5-((5-(2-оксо-2-(2-фенил-5-метил-4-оксазолил)этокси)-2-пиридил)метил)тиазолидин-2,4-дион а (соединение N 1-2a-1)



В 50 мл тетрагидрофурана, обезвоженного молекулярным ситом, растворяют 0,48 г (1,1 ммоль) 5-((5-(2-оксо-2-(2-фенил-5-метил-4-оксазолил)

этокси)-2-пиридил)метилен)тиазолидин-2,4-диона (соединение N 1-1a-1). К этому раствору добавляют 0,9 г 10% палладированного угля и проводят каталитическое восстановление при комнатной температуре при давлении водорода 7 атм в течение 5 суток. После удаления катализатора фильтрацией отгоняют растворитель при пониженном давлении и получают остаток, и полученный таким образом остаток подвергают колоночной хроматографии на силикагеле (элюент 5% метанола в хлороформе). Получают 0,38 г (26,3%) целевого продукта в виде бледно-желтого порошка (соединение N 1-2a-1).

Т. пл. 56-62 °С.

М.-с. (FAB) m/e: 424 (M+H)⁺.

¹H ЯМР (CDCl₃) δ : 2,67 (3H, с), 3,26 (1H, дд, J=10,3, 15,7 Гц), 3,6-7 (1H, дд, J=3,8, 15,7 Гц), 4,76 (1H, дд, J=3,8, 10,3 Гц), 5,36 (2H, с), 7,06-7,08 (1H, м), 7,1-7,2 (1H, м), 7,42-7,44 (3H, м), 7,97-7,99 (2H, м), 8,23-8,24 (1H, м), 8,4 (1H, шир. с).

Таким же способом, какой описан выше, получают соединения NN (1-2a-2) и (1-2a-4)-(1-2a-25). (Таблица к примеру 2 приведена в конце описания, где Z соответствует заместителям в соединении формулы 1-2a).

1-2a-2

¹H ЯМР (d⁶-ДМСО) δ : 3,34 (1H, дд, J=10, 15 Гц), 3,49 (3H, с), 3,73 (1H, дд, J=5, 15 Гц), 4,83 (1H, дд, J=5, 10 Гц), 5,19 (2H, с), 7,11-7,14 (1H, м), 7,33-7,36 (1H, м), 8,32-8,35 (1H, м), 9,0 (1H). (Таблица по примерам с 1-2a-4 по 1-2a-25 приведена в конце описания).

1-2a-4

¹H ЯМР (CDCl₃, 90 МГц) δ : 2,44 (3H, с), 2,72 (3H, с), 3,75 (2H, м), 4,90 (1H, м), 5,48 (2H, с), 7,31 (3H, м), 7,92 (3H, м), 8,35 (1H, м).

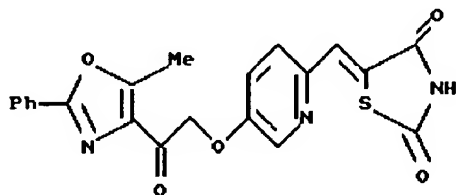
1-2a-5

¹H ЯМР (CDCl₃, 90 МГц) δ : 2,40 (3H, с), 2,70 (3H, с), 3,50 (2H, м), 4,80 (1H, м), 5,38 (2H, с), 7,25 (3H, м), 7,83 (3H, м), 8,29 (1H, м).

Пример 3

Получение

5-((5-(2-гидрокси-2-(2-фенил-5-метил-4-оксазолил)этокси)-2-пиридил)метил)тиазолидин-2,4-диона (соединение N I-2a-3)



В 5 мл метанола, обезвоженного молекулярным ситом, растворяют 200 мг (0,47 ммоль)

5-((5-(2-оксо-2-(2-фенил-5-метил-4-оксазолил)этокси)-2-пиридил)метил)тиазолидин-2,4-диона (соединение N I-2a-1). К этому раствору добавляют 21,5 мг борогидрида натрия и полученный в результате раствор перемешивают при комнатной температуре в течение 1 дня. Реакцию прекращают насыщенным водным раствором хлорида аммония и реакционную смесь экстрагируют хлороформом. Полученный таким образом продукт реакции промывают солевым раствором и сушат безводным сульфатом магния. После удаления фильтрацией осушающего агента растворитель отгоняют при пониженном давлении и получают остаток, и полученный таким образом остаток подвергают колоночной хроматографии на силикагеле (элюент 10% метанола в хлороформе). Получают 203 мг (количественный выход) целевого продукта в виде бледно-коричневого порошка (соединение N I-2a-3).

Т. пл. 55-72°C.

М.-с. (FAB) m/e: 426 (M+H)⁺

¹H ЯМР (d⁶-DMCO) δ : 2,46 (3H, c), 3,33 (1H, dd, J=10,0, 15,6 Гц), 3,69 (1H, dd, J=3,4, 15,6 Гц), 4,24 (1H, dd, J=4,6, 9,5 Гц), 4,37 (1H, dd, J=7,6, 9,5 Гц), 4,81 (1H, dd, J=3,4, 10,0 Гц), 5,10 (1H, dd, J=4,6, 7,6 Гц), 7,10-7,15 (1H, м), 7,2-7,3 (1H, м), 7,4-7,7 (3H, м), 7,95-8,05 (2H, м), 8,25-8,30 (1H, м), 8,7 (1H, шир.с.).

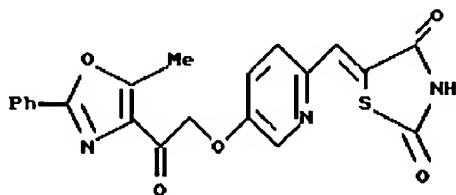
Тем же способом, который описан выше, были получены следующие соединения N от (I-1a-40) до (I-1a-46) (см. таблицу в конце описания, где Z соответствует заместителям в соединениях формулы I-1a).

Тем же способом, который описан выше, были получены следующие соединения N от (I-2a-30) до (I-1a-34) (см. таблицу в конце описания, где Z соответствует заместителям в соединениях формулы I-2a).

Пример 4

Получение

5-((5-(2-гидрокси-2-(2-фенил-5-метил-4-оксазолил)этокси)-2-пиридил)метилиден)роданина (соединение N I-1b-1)



В 10 мл толуола, обезвоженного молекулярным ситом, суспендируют 200 мг

(0,62 ммоль) соединения N I-1 и 91 мг роданина и полученную в результате суспензию растворяют при нагревании. К этому раствору при охлаждении водой добавляют 11,2 мг ледяной уксусной кислоты и затем 10,6 мг пиперидина и полученный в результате раствор перемешивают при комнатной температуре в течение 2 суток. После определения тонкослойной хроматографией исчезновения исходных веществ выпавшие в осадок кристаллы собирают фильтрацией. Полученное таким образом кристаллическое вещество промывают холодным толуолом и сушат при 50°C в течение 2,5 часов, получают 220 мг (81,1%) целевого продукта в виде желтого порошка (соединение N I-1b-1). Кроме того, из фильтрата после удаления кристаллического вещества извлекают еще 50 мг целевого продукта.

Т. пл. 217,5-218,5°C.

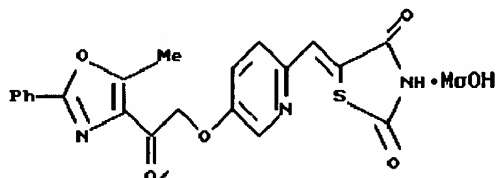
М.-с. (FAB) m/e: 438(M+H)⁺.

¹H ЯМР (d⁶-DMCO) δ : 2,69 (3H, c), 5,66 (2H, c), 7,5-7,7 (5H, м), 7,8-7,9 (1H, м), 8,0-8,1 (2H, м), 8,5-8,6 (1H, м), 13,6 (1H, шир.с.).

Пример 5

Получение монометансульфоната

5-((5-(2-оксо-2-(2-фенил-5-метил-4-оксазолил)этокси)-2-пиридил)метилиден)тиазолидин-2,4-диона (соединение N I-1a-1-1)



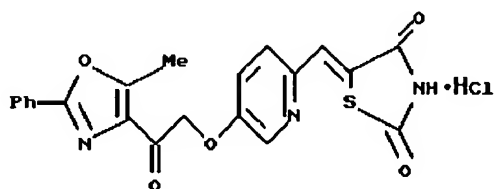
0,2 г (0,48 ммоль) Соединения N I-1a-1 растворяют в 6 г тетрагидрофурана при 30-40 °C. К этому раствору прибавляют по каплям 1,0 г метансульфокислоты и полученный раствор перемешивают при комнатной температуре. Примерно через 5 минут начинает выпадать желтый осадок метансульфоната. После перемешивания реакционной смеси при комнатной температуре 30 минут ее перемешивают при 0-5°C еще 30 минут. Осадок метансульфоната отделяют фильтрованием и промывают 1 г холодного тетрагидрофурана. После высушивания в вакууме при 60 °C в течение 1 часа получают 0,2 г (0,39 ммоль, 81,4%) бледно-желтого порошка целевого продукта.

Т. пл. 231°C.

Пример 6

Получение моногидрохлорида

5-((5-(2-гидрокси-2-(2-фенил-5-метил-4-оксазолил)этокси)-2-пиридил)метилиден)тиазолидин-2,4-диона (соединение N I-1a-1-2)



35,0 г (83,1 ммоль) Соединения N I-1a-1

растворяют в 1751 г тетрагидрофурана при 60 °С. После охлаждения этого раствора до 25°С прибавляют по каплям 146 г 41%-ного хлористого водорода в спирте, и полученный раствор перемешивают при комнатной температуре. Примерно через пять минут начинает осажаться желтый осадок гидрохлорида. После перемешивания реакционной смеси при комнатной температуре в течение 30 минут прибавляют по каплям 875 г диэтилового эфира за 30 минут. После перемешивания реакционной смеси при комнатной температуре в течение 30 минут ее перемешивают еще 30 минут при 3-5°С. Осадок гидрохлорида отделяют путем фильтрования и высушивают в вакууме при 30°С в течение 2 часов, получают 32,4 г (70,8 ммоль, 85,6%) бледно-желтого порошка целевого продукта.

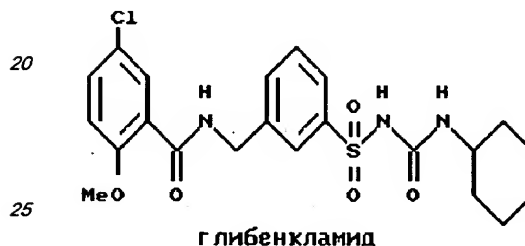
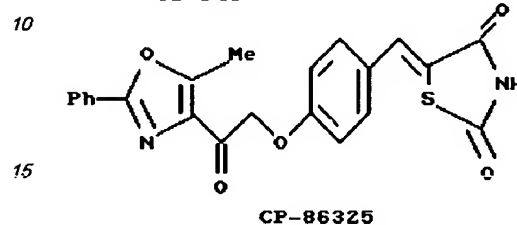
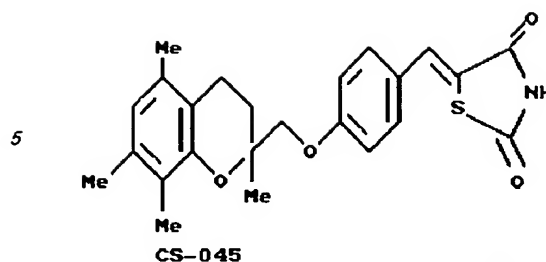
Т. пл. 240-242°С.

Тестовый пример 1. Определение гипогликемического действия

Мышей КК и ККАу, модели NIDDM (самцы, возраст 6-7 недель) (Nakamura, Proc. Jpn. Acad. 38, 348-352, 1962; Iwatsuka et al., Endocrinol Jpn., 17 23-35, 1970) приобретают у Nihon Clea. Им создают возможность свободного доступа к высококалорийной пище (CMF, Oriental Yeast) и воде. Обследуют мышей массой около 40 г.

Кровь (20 мкл), взятую из ретроорбитального синуса, разводят в 60-единичном растворе гепарина и центрифугируют на микроцентрифуге. Проверяют супернатант. Содержание глюкозы определяют глюкозооксидазным методом (глюкозный анализатор 11, Bektan). Проверяют группу из 3-4 мышей, имеющих глюкозный показатель крови более 200 мг/дл, у которых глюкозный показатель крови не снижается более чем на 10%, в течение 24 часов после однократного перорального введения 0,5% карбоксиметилцеллюлозы (CMC) в физиологическом растворе.

Все проверяемые соединения, суспендированные в 0,5% карбоксиметилцеллюлозе (CMC) в физиологическом растворе, вводят мышам перорально. Кровь берут до введения и через 24 часа после введения из ретроорбитального синуса, и измеряют глюкозный показатель крови вышеупомянутым методом. Гипогликемическую активность выражают в виде процента снижения содержания глюкозы в крови, вычисленного до введения и через 24 часа после введения (см. результаты мыши КК и мыши ККАу в конце описания).



Соединения настоящего изобретения обнаруживают гипогликемическую активность, по существу, в той же или в большей степени, чем CS-045 и CP-86325, с которыми их сравнивают, и которые используют в качестве контрольных соединений. Глибенкламид (инсулин-секретирующее средство) не обнаруживает гипогликемической активности при данном испытании.

Измерение гипогликемического эффекта
Жирные мыши с сахарным диабетом вида NIDDM (самцы, возраст 5 недель) (Tokuyama, Y. и др., Diabetes, 1447-1457, 1995) были куплены у Genetic Models Inc. Им давали неограниченный избыток высококалорийной смеси (CMF, Oriental Yeast (азиатские дрожжи)) и воды. Была изучена группа из 4 мышей с содержанием глюкозы в крови более 200 мг/дл. Исследуемые соединения, суспендированные в 0,5%-ном солевом растворе карбоксиметилцеллюлозы (CMC), вводились мышам перорально один раз в день в течение 14 дней. Перед введением (день 0) на 4, 7 и 14 дни образцы крови (по 20 μ л), отобранные из ретро-орбитального синуса, растворяли в 60 единицах раствора гепарин-натрий и центрифугировали в микроцентрифуге. Концентрацию глюкозы в супернатанте определяли по способу окисления глюкозы (Glucose Analyzer 11, Beckman). Гипогликемическая активность выражена в процентах уменьшения глюкозы в крови, рассчитанной до и в вышеуказанные дни после введения.

Соединения данного изобретения проявляют гипогликемическую активность (см. табл. А в конце описания).

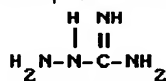
Тестовый пример 2. Определение антигликационного действия

Когда у больного диабетом высокая концентрация глюкозы сохраняется длительное время, некоторые виды белков подвергаются неферментативной гликации. Предполагается, что подвергшиеся гликации

белки индуцируют диабетические осложнения (Brownlee, Diabetes, 41 Suppl 2, 57-60, 1992).

Поскольку подвергшийся гликации белок является флуоресцентным, количество такого белка можно определить с помощью флуоресценции в соответствии с предыдущими сообщениями (Doi et al., Proc. Natl. Acad. Sci. USA., 89, 2873-2877, 1992; Mitsuhashi et al., Diabetes, vol. 42, 826-832, 1993). Экспериментальную процедуру модифицируют следующим образом. Пять процентов бычьего сывороточного альбумина (BSA), содержащегося в 0,5 М глюкоза-6-фосфат-2Na (5% BSA-0,5 М G6P), стерилизуют фильтрацией (размер пор фильтра 0,45 мкм) и инкубируют при 37°C; материал позитивного контроля инкубируют с 1% диметилсульфоксида (ДМСО) при 37°C; "пустышку" инкубируют при 4°C. Все проверяемые соединения, растворенные в ДМСО (конечная концентрация ДМСО менее 1%), добавляют в 5% BSA-0,5 М G6P. После 10-суточной инкубации 5% BSA-0,5 М G6P с соединением позитивный контроль и "пустышку" диализуют против 2 л забуференного фосфатом солевого раствора в течение 24 часов (молекулярная масса фракций 12000-14000). Диализованный раствор разбавляют водой в 4 раза и определяют флуоресценцию (эксп. 370 нм-эксм. 440 нм). Концентрацию белка в диализованном растворе (10 мкл которого разводят дистиллированной водой до 20 раз) определяют по методу Лоури и выражают флуоресценцию на мг белка. Контроль (100%) представляет собой позитивный контроль минус "пустышка".

Антигликационное действие вычисляют как процент от контрольных данных (см. табл. В в конце описания).



аминогуанидин

Соединения настоящего изобретения обнаруживают более сильную антигликационную активность, чем аминогуанидин, используемый в качестве контрольного материала. CS-045 и CP-86325 не обнаруживают антигликационной активности.

Тестовый пример 3. Определение активности ингибирования альдозоредуктазы

Готовят AR из почек крыс следующим образом. Почки крыс заливают охлажденным льдом солевым раствором, чтобы удалить кровь, и затем гомогенизируют в тефлоновом гомогенизаторе с 3 объемами холодного 5 М трис-HCl буфера (pH 7,4). Гомогенат центрифугируют при 45000 x g в течение 40 минут для удаления нерастворимых материалов и супернатантную фракцию используют в качестве образца альдозоредуктазы (AR).

Определение AR и действия проверяемых соединений

Активность AR проверяют по модифицированному методу Inukai et al., (Jpn. J. Pharmacol., 61, 221-227, 1993). Поглощение никотинамидадениндинуклеотидфосфата (NADPH) (340 нм) - окислителя кофактора для AR-определяют спектрометром (UV-240,

Shimodzu, Kyoto). Испытания проводят в 0,1 М фосфата натрия (pH 6,2), содержащем 0,4 М сульфата лития, 0,15 М NADPH, фермент, различные концентрации проверяемых соединений и 10 мМ DL-глицеральдегида. Контрольная проба содержит все вышеперечисленные ингредиенты за исключением DL глицеринового альдегида. Реакцию начинают добавлением субстрата (DL- глицеральдегид). Скорость реакции измеряют при 30 °C в течение 2 минут. Все проверяемые соединения растворяют в диметилсульфоксиде (ДМСО). Конечная концентрация ДМСО в реакционной смеси никогда не превышает 1%. Действие ингибиторов оценивают как концентрацию проверяемого соединения, требуемую для 50% ингибирования активности фермента (IC₅₀).

Результатом этих испытаний является то, что соединения настоящего изобретения обнаруживают удовлетворительную активность ингибирования альдозоредуктазы.

Пример состава 1

Таблетки

Соединение настоящего изобретения - 1,0

г
Лактоза - 5,0 г
Порошок кристаллической целлюлозы - 8,0 г

Кукурузный крахмал - 3,0 г
Гидроксипропилцеллюлоза - 1,0 г
СМС-Са - 1,5 г

Стеарат магния - 0,5 г
Всего - 20,0 г

Все вышеперечисленные компоненты смешивают обычным способом, и затем таблетуют; получают 100 таблеток, каждая из которых содержит 10 мг активного ингредиента.

Пример состава 2

Капсулы

Соединение настоящего изобретения - 1,0

г
Лактоза - 3,5 г
Кристаллическая целлюлоза, порошок - 10,0 г

Стеарат магния - 0,5 г
Всего - 15,0 г

Вышеперечисленные компоненты смешивают обычным способом и этой смесью заполняют желатиновые капсулы N 4, получают 100 капсул, каждая из которых содержит 10 мг активного ингредиента.

Пример состава 3

Мягкие капсулы

Соединение настоящего изобретения - 1,00 г

ПЭГ (полиэтиленгликоль) 400 - 3,89 г
Триглицерид насыщенной жирной кислоты - 15,00 г

Мягкое масло - 0,01 г
Полисорбат 80 - 0,10 г
Всего - 20,00 г

Вышеперечисленные соединения смешивают и заполняют этой смесью, обычным способом, мягкие желатиновые капсулы N 3. и получают 100 мягких капсул, каждая из которых содержит 10 мг активного ингредиента.

Пример состава 4

Мазь

Соединение настоящего изобретения - 1,0 г (10,0 г)

Медицинское парафиновое масло - 10,0 г

(10,0 г)

Цетанол - 20,0 г (20,0 г)
Белый вазелин - 68,4 г (59,4 г)
Этилпарабен - 0,1 г (0,1 г)
1-Ментол - 0,5 г (0,5 г)

Всего - 100,0 г

Перечисленные выше компоненты смешивают обычным способом и получают 1% (10%) мазь.

Пример состава 5

Суппозиторий

Соединение настоящего изобретения - 1,0

г

Witepsol H15^{*} - 46,9 г

Witepsol H35^{*} - 52,0 г

Полисорбат 80 - 0,1 г

Всего - 100,0 г

* Торговая марка триглицеридов

Вышеперечисленные компоненты смешивают в расплавленном состоянии обычным способом и выливают в формы для суппозитория, затем охлаждают для отверждения и получают 100 суппозитория, каждый по 1 г, содержащий 10 мг активного ингредиента.

Пример состава 6

Гранулы

Соединение настоящего изобретения - 1,0

г

Лактоза - 6,0 г

Кристаллическая целлюлоза, порошок - 6,5 г

Кукурузный крахмал - 5,0 г

Гидроксипропилцеллюлоза - 1,0 г

Стеарат магния - 0,5 г

Всего - 20,0 г

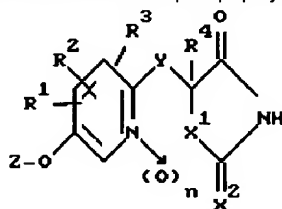
Вышеперечисленные компоненты гранулируют обычным способом и упаковывают, получают 100 упаковок, каждая из которых содержит 200 мг гранул, и, таким образом, каждая упаковка содержит 10 мг активного ингредиента.

Промышленная пригодность

Так как соединения настоящего изобретения обладают гипогликемическим действием, антигликационным действием и активностью ингибирования альдозоредуктазы и имеют малую токсичность, они пригодны для предупреждения или лечения диабетических осложнений, включая диабетические глазные болезни (такие как диабетическая катаракта и диабетическая ретинопатия), диабетическую невропатию, диабетическую нефропатию, диабетическую гангрену и т.п.

Формула изобретения:

1. Соединение тиазолидина пиридинового типа и его соль общей формулы I



в которой X¹ представляет собой S;

X²-S или O;

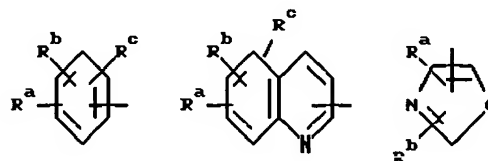
Y - CR⁶R⁷ (R⁶ и R⁷ каждый - атом водорода, или R⁷ вместе с R⁴ образует связь);

Z представляет собой (C₁-C₁₀) -алкильную группу, которая может быть замещена самое

большее тремя (C₁-C₇) -алкоксильными группами), замещенную силильную группу; или -A-B (A представляет собой двухвалентную (C₁-C₆) - насыщенную или (C₂-C₆) - ненасыщенную углеводородную группу, которая может быть замещена самое большее тремя гидроксильными, оксо- и (C₁-C₇) -алкильными группами, и B представляет собой

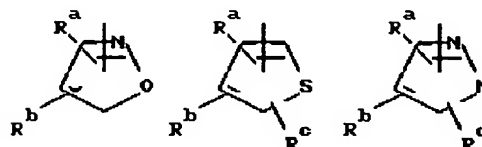
5

10



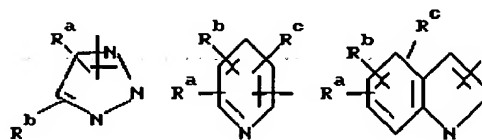
15

20

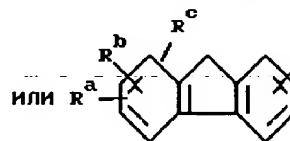


25

30



35



40

45

50

55

60

при этом каждый из R^a и R^b независимо представляет собой атом водорода, (C₁-C₇) -алкильную группу, которая может быть замещена гидроксильной группой или оксогруппой, атом галогена, фенил, α-нафтил, β-нафтил, фурил, (каждая из упомянутых групп - фенила, β-нафтила, α-нафтила, фурила может быть замещена метилом, метоксигруппой, бензилоксигруппой, гидроксильной группой, галогеном и фенильной группой), и R^c представляет собой атом водорода или (C₁-C₇) -алкильную группу;

R¹, R² и R³ каждый - водород;

R⁴ - атом водорода или вместе с R⁷ образует связь;

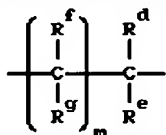
n = O.

2. Соединение и его соль по п.1, где X¹ представляет собой S, Y-CR⁶R⁷ (R⁶ представляет собой атом водорода, и R³ - атом водорода или вместе с R⁴ образует связь), R⁴ - атом водорода или вместе с R⁷ образует связь, A представляет собой двухвалентную (C₁-C₆) - насыщенную углеводородную группу, которая может быть замещена гидроксильной или оксогруппой.

3. Соединение и его соль по п.1, где Y представляет -CH₂-, и R⁴ - атом водорода.

4. Соединение и его соль по п.1, где Y-CHR⁷ (R⁷ вместе с R⁴ образует связь, и R⁴ вместе с R⁷ образует связь).

5. Соединение и его соль по п.1, где A представляет собой

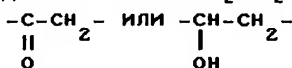


где m = 0,1;

каждый из R^d и R^e независимо - атом водорода;

каждый из R^f и R^g независимо - атом водорода или гидроксильная группа или R^f и R^g вместе образуют оксогруппу.

6. Соединение и его соль по п.1, где A представляет собой -CH₂-CH₂-



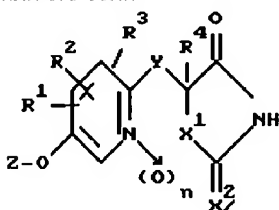
7. Гипогликемическое средство, отличающееся тем, что содержит в качестве активного агента соединение тиазолидина пиридинового типа или его соль по п. 1.

8. Антигликационное средство, отличающееся тем, что содержит в качестве активного агента соединение тиазолидина пиридинового типа или его соль по п. 1.

9. Фармацевтическое средство, ингибирующее гипергликемию, неферментативную гликацию и альдозоредуктазу, для предупреждения и лечения сахарного диабета и диабетических осложнений, отличающееся тем, что оно содержит в качестве активного агента соединение тиазолидина пиридинового типа или его соль по п.1, в эффективном количестве.

Приоритет по признакам:

28.03.94 - производное тиазолидина пиридинового типа формулы I или его соли



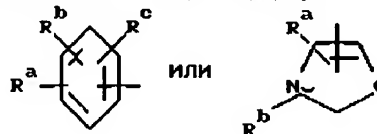
где X¹-S;

X²-S или O;

Y - CR⁶R⁷ (каждый из R⁶ и R⁷ - водород или R⁷ и R⁴ вместе образуют связь);

Z-C₁-C₁₀-алкил (этот алкил может быть замещен самое большее тремя C₁-C₇-алкоксигруппами), замещенная

силильная группа или -A-B (A-двухвалентная C₁-C₆-насыщенная углеводородная группа, которая может быть замещена самое большее тремя гидроксильными или оксогруппами, и B-группа формулы



где каждый из R^a и R^b независимо друг от друга - атом водорода, C₁-C₇-алкил, фенил;

R^c - атом водорода или C₁-C₇-алкил;

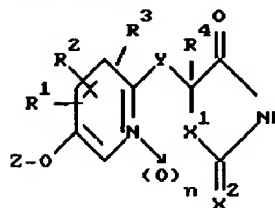
R¹, R² и R³ - атомы водорода;

R⁴ - атом водорода или образует связь вместе с R⁷; и

n = 0;

29.11.94 - производное тиазолидина типа формулы I

или его соли

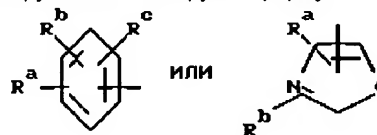


где X¹-S;

X²-S или O;

Y-CR⁶R⁷ (каждый из R⁶ и R⁷ - водород или R⁷ и R⁴ вместе образуют связь);

Z-C₁-C₁₀-алкил, который может быть замещен самое большее тремя C₁-C₇-алкоксигруппами), замещенная силильная группа или -A-B (A - двухвалентная C₁-C₆ насыщенная углеводородная группа, которая может быть замещена самое большее тремя гидроксильными или оксогруппами, и B - группа формулы



где каждый из R^a и R^b независимо друг от друга - атом водорода, C₁-C₇-алкил, атом галогена, фенил, β-нафтил, фурил (указанные фенил, β-нафтил и фурил могут быть замещены метилами, метоксигруппами, галогенами и фенилами);

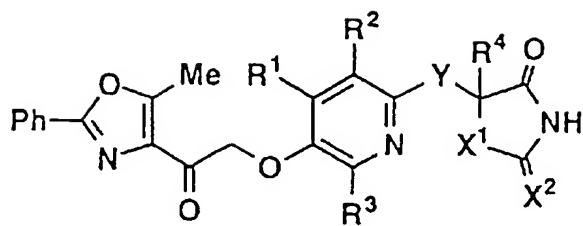
R^c - атом водорода или C₁-C₇-алкил;

R¹, R² и R³ - атомы водорода;

R⁴ - атом водорода или образует связь вместе с R⁷;

n = 0.

Таблица 2

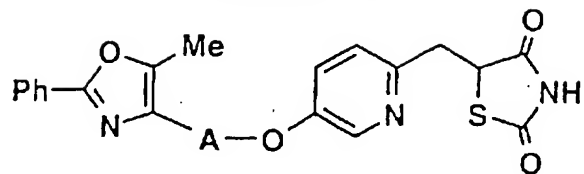


R ¹	R ²	R ³	Y	R ⁴	X ¹	X ²
H	Cl	H	-CH=	связь с. R ⁷	S	O
Br	H	Br	-CH=	связь с. R ⁷	S	O
I	H	H	-CH=	связь с. R ⁷	S	O
H	OMe	H	-CH=	связь с. R ⁷	S	O
OMe	H	H	-CH=	связь с. R ⁷	S	O
H	Me	H	-CH=	связь с. R ⁷	S	O
Me	H	H	-CH=	связь с. R ⁷	S	O
H	H	Me	-CH=	связь с. R ⁷	S	O
H	OH	H	-CH=	связь с. R ⁷	S	O
OH	H	H	-CH=	связь с. R ⁷	S	O
H	Cl	H	-CH ₂ -	H	S	O
Br	H	Br	-CH ₂ -	H	S	O
H	OMe	H	-CH ₂ -	H	S	O
OMe	H	H	-CH ₂ -	H	S	O
H	Me	H	-CH ₂ -	H	S	O
Me	H	H	-CH ₂ -	H	S	O
H	H	Me	-CH ₂ -	H	S	O
H	OH	H	-CH ₂ -	H	S	O
OH	H	H	-CH ₂ -	H	S	O

RU 2125053 C1

RU 2125053 C1

Таблица 3

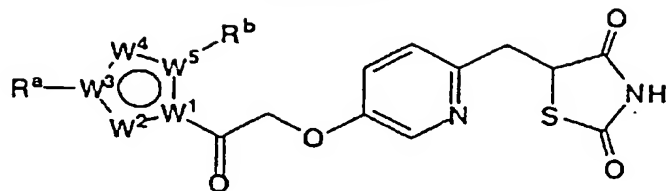


A
-CH ₂ -
-CH(Me)-
-C(Me) ₂ -
-CH ₂ CH ₂ -
-CH ₂ CH(Me)-
-CH ₂ C(Me) ₂ -
-COCH ₂ -
-COCH(Me)-
-COC(Me) ₂ -
-CH(OH)CH ₂ -
-CH(OH)CH(Me)-
-CH(OH)C(Me) ₂ -
-CH=CH-
-CH=CH(Me)-
-C≡C-

RU 2125053 C1

RU 2125053 C1

Таблица 4



W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b
C	N	C	O	C	Ph	H
C	N	C	O	C	Ph	Me
C	N	C	O	C	Ph	Et
C	N	C	O	C	Ph	n-Hex
C	N	C	O	C	Ph	c-Pr
C	N	C	O	C	Ph	c-Hex
C	N	C	O	C	Ph	OH
C	N	C	O	C	Ph	CH ₂ OH
C	N	C	O	C	Ph	OMe
C	N	C	O	C	Ph	SMe
C	N	C	O	C	Ph	Cl
C	N	C	O	C	Ph	CF ₃
C	N	C	O	C	Ph	Ph
C	N	C	O	C	H	H
C	N	C	O	C	H	Me
C	N	C	O	C	H	Et
C	N	C	O	C	H	n-Hex
C	N	C	O	C	H	c-Pr
C	N	C	O	C	H	c-Hex
C	N	C	O	C	H	OH
C	N	C	O	C	H	CH ₂ OH
C	N	C	O	C	H	OMe
C	N	C	O	C	H	SMe
C	N	C	O	C	H	Cl
C	N	C	O	C	H	CF ₃
C	N	C	O	C	H	Ph
C	N	C	O	C	Me	H
C	N	C	O	C	Me	Me
C	N	C	O	C	Me	Et
C	N	C	O	C	Me	n-Hex
C	N	C	O	C	Me	c-Pr
C	N	C	O	C	Me	c-Hex
C	N	C	O	C	Me	OH
C	N	C	O	C	Me	CH ₂ OH
C	N	C	O	C	Me	OMe

RU 2125053 C1

RU 2125053 C1

Таблица 4 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b
C	N	C	O	C	Me	SMe
C	N	C	O	C	Me	Cl
C	N	C	O	C	Me	CF ₃
C	N	C	O	C	Me	Ph
C	N	C	O	C	Et	H
C	N	C	O	C	Et	Me
C	N	C	O	C	Et	Et
C	N	C	O	C	Et	n-Hex
C	N	C	O	C	Et	c-Pr
C	N	C	O	C	Et	c-Hex
C	N	C	O	C	Et	OH
C	N	C	O	C	Et	CH ₂ OH
C	N	C	O	C	Et	OMe
C	N	C	O	C	Et	SMe
C	N	C	O	C	Et	Cl
C	N	C	O	C	Et	CF ₃
C	N	C	O	C	Et	Ph
C	N	C	O	C	n-Pr	H
C	N	C	O	C	n-Pr	Me
C	N	C	O	C	n-Pr	Et
C	N	C	O	C	n-Pr	n-Hex
C	N	C	O	C	n-Pr	c-Pr
C	N	C	O	C	n-Pr	c-Hex
C	N	C	O	C	n-Pr	OH
C	N	C	O	C	n-Pr	CH ₂ OH
C	N	C	O	C	n-Pr	OMe
C	N	C	O	C	n-Pr	SMe
C	N	C	O	C	n-Pr	Cl
C	N	C	O	C	n-Pr	CF ₃
C	N	C	O	C	n-Pr	Ph
C	N	C	O	C	n-Hex	H
C	N	C	O	C	n-Hex	Me
C	N	C	O	C	n-Hex	Et
C	N	C	O	C	n-Hex	n-Hex
C	N	C	O	C	n-Hex	c-Pr
C	N	C	O	C	n-Hex	c-Hex
C	N	C	O	C	n-Hex	OH
C	N	C	O	C	n-Hex	CH ₂ OH
C	N	C	O	C	n-Hex	OMe
C	N	C	O	C	n-Hex	SMe
C	N	C	O	C	n-Hex	Cl
C	N	C	O	C	n-Hex	CF ₃
C	N	C	O	C	n-Hex	Ph
C	N	C	O	C	i-Pr	H

RU 2125053 C1

RU 2125053 C1

Таблица 4 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b
C	S	C	N	C	Me	SMe
C	S	C	N	C	Me	Cl
C	S	C	N	C	Me	CF ₃
C	S	C	N	C	Me	Ph
C	S	C	N	C	Et	H
C	S	C	N	C	Et	Me
C	S	C	N	C	Et	Et
C	S	C	N	C	Et	n-Hex
C	S	C	N	C	Et	c-Pr
C	S	C	N	C	Et	c-Hex
C	S	C	N	C	Et	OH
C	S	C	N	C	Et	CH ₂ OH
C	S	C	N	C	Et	OMe
C	S	C	N	C	Et	SMe
C	S	C	N	C	Et	Cl
C	S	C	N	C	Et	CF ₃
C	S	C	N	C	Et	Ph
C	S	C	N	C	n-Pr	H
C	S	C	N	C	n-Pr	Me
C	S	C	N	C	n-Pr	Et
C	S	C	N	C	n-Pr	n-Hex
C	S	C	N	C	n-Pr	c-Pr
C	S	C	N	C	n-Pr	c-Hex
C	S	C	N	C	n-Pr	OH
C	S	C	N	C	n-Pr	CH ₂ OH
C	S	C	N	C	n-Pr	OMe
C	S	C	N	C	n-Pr	SMe
C	S	C	N	C	n-Pr	Cl
C	S	C	N	C	n-Pr	CF ₃
C	S	C	N	C	n-Pr	Ph
C	S	C	N	C	n-Hex	H
C	S	C	N	C	n-Hex	Me
C	S	C	N	C	n-Hex	Et
C	S	C	N	C	n-Hex	n-Hex
C	S	C	N	C	n-Hex	c-Pr
C	S	C	N	C	n-Hex	c-Hex
C	S	C	N	C	n-Hex	OH
C	S	C	N	C	n-Hex	CH ₂ OH
C	S	C	N	C	n-Hex	OMe
C	S	C	N	C	n-Hex	SMe
C	S	C	N	C	n-Hex	Cl
C	S	C	N	C	n-Hex	CF ₃
C	S	C	N	C	n-Hex	Ph
C	S	C	N	C	i-Pr	H

RU 2125053 C1

RU 2125053 C1

Таблица 4 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b
C	N	C	O	C	i-Pr	Me
C	N	C	O	C	i-Pr	Et
C	N	C	O	C	i-Pr	n-Hex
C	N	C	O	C	i-Pr	c-Pr
C	N	C	O	C	i-Pr	c-Hex
C	N	C	O	C	i-Pr	OH
C	N	C	O	C	i-Pr	CH ₂ OH
C	N	C	O	C	i-Pr	OMe
C	N	C	O	C	i-Pr	SMe
C	N	C	O	C	i-Pr	Cl
C	N	C	O	C	i-Pr	CF ₃
C	N	C	O	C	i-Pr	Ph
C	N	C	O	C	t-Bu	H
C	N	C	O	C	t-Bu	Me
C	N	C	O	C	t-Bu	Et
C	N	C	O	C	t-Bu	n-Hex
C	N	C	O	C	t-Bu	c-Pr
C	N	C	O	C	t-Bu	c-Hex
C	N	C	O	C	t-Bu	OH
C	N	C	O	C	t-Bu	CH ₂ OH
C	N	C	O	C	t-Bu	OMe
C	N	C	O	C	t-Bu	SMe
C	N	C	O	C	t-Bu	Cl
C	N	C	O	C	t-Bu	CF ₃
C	N	C	O	C	t-Bu	Ph
C	N	C	O	C	c-Hex	H
C	N	C	O	C	c-Hex	Me
C	N	C	O	C	c-Hex	Et
C	N	C	O	C	c-Hex	n-Hex
C	N	C	O	C	c-Hex	c-Pr
C	N	C	O	C	c-Hex	c-Hex
C	N	C	O	C	c-Hex	OH
C	N	C	O	C	c-Hex	CH ₂ OH
C	N	C	O	C	c-Hex	OMe
C	N	C	O	C	c-Hex	SMe
C	N	C	O	C	c-Hex	Cl
C	N	C	O	C	c-Hex	CF ₃
C	N	C	O	C	c-Hex	Ph
C	N	C	O	C	3-Ц-Гексенил	H
C	N	C	O	C	3-Ц-Гексенил	Me
C	N	C	O	C	3-Ц-Гексенил	Et
C	N	C	O	C	3-Ц-Гексенил	n-Hex
C	N	C	O	C	3-Ц-Гексенил	c-Pr
C	N	C	O	C	3-Ц-Гексенил	c-Hex

RU 2 1 2 5 0 5 3 C 1

RU 2 1 2 5 0 5 3 C 1

Таблица 4 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b
C	N	C	O	C	3-ц-гексенил	ОН
C	N	C	O	C	3-ц-гексенил	CH ₂ ОН
C	N	C	O	C	3-ц-гексенил	OMe
C	N	C	O	C	3-ц-гексенил	SMe
C	N	C	O	C	3-ц-гексенил	Cl
C	N	C	O	C	3-ц-гексенил	CF ₃
C	N	C	O	C	3-ц-гексенил	Ph
C	N	C	O	C	CH ₂ ОН	H
C	N	C	O	C	CH ₂ ОН	Me
C	N	C	O	C	CH ₂ ОН	Et
C	N	C	O	C	CH ₂ ОН	n-Hex
C	N	C	O	C	CH ₂ ОН	c-Pr
C	N	C	O	C	CH ₂ ОН	c-Hex
C	N	C	O	C	CH ₂ ОН	ОН
C	N	C	O	C	CH ₂ ОН	CH ₂ ОН
C	N	C	O	C	CH ₂ ОН	OMe
C	N	C	O	C	CH ₂ ОН	SMe
C	N	C	O	C	CH ₂ ОН	Cl
C	N	C	O	C	CH ₂ ОН	CF ₃
C	N	C	O	C	CH ₂ ОН	Ph
C	N	C	O	C	CH ₂ Ph	H
C	N	C	O	C	CH ₂ Ph	Me
C	N	C	O	C	CH ₂ Ph	Et
C	N	C	O	C	CH ₂ Ph	n-Hex
C	N	C	O	C	CH ₂ Ph	c-Pr
C	N	C	O	C	CH ₂ Ph	c-Hex
C	N	C	O	C	CH ₂ Ph	ОН
C	N	C	O	C	CH ₂ Ph	CH ₂ ОН
C	N	C	O	C	CH ₂ Ph	OMe
C	N	C	O	C	CH ₂ Ph	SMe
C	N	C	O	C	CH ₂ Ph	Cl
C	N	C	O	C	CH ₂ Ph	CF ₃
C	N	C	O	C	CH ₂ Ph	Ph
C	N	C	O	C	α-нафтил	H
C	N	C	O	C	α-нафтил	Me
C	N	C	O	C	α-нафтил	Et
C	N	C	O	C	α-нафтил	n-Hex
C	N	C	O	C	α-нафтил	c-Pr
C	N	C	O	C	α-нафтил	c-Hex
C	N	C	O	C	α-нафтил	ОН
C	N	C	O	C	α-нафтил	CH ₂ ОН
C	N	C	O	C	α-нафтил	OMe
C	N	C	O	C	α-нафтил	SMe
C	N	C	O	C	α-нафтил	Cl

RU 2125053 C1

RU 2125053 C1

Таблица 4 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b
C	N	C	O	C	α - нафтил	CF ₃
C	N	C	O	C	α - нафтил	Ph
C	N	C	O	C	β - нафтил	H
C	N	C	O	C	β - нафтил	Me
C	N	C	O	C	β - нафтил	Et
C	N	C	O	C	β - нафтил	n-Hex
C	N	C	O	C	β - нафтил	c-Pr
C	N	C	O	C	β - нафтил	c-Hex
C	N	C	O	C	β - нафтил	OH
C	N	C	O	C	β - нафтил	CH ₂ OH
C	N	C	O	C	β - нафтил	OMe
C	N	C	O	C	β - нафтил	SMe
C	N	C	O	C	β - нафтил	Cl
C	N	C	O	C	β - нафтил	CF ₃
C	N	C	O	C	β - нафтил	Ph
C	N	C	O	C	2-пиридил	H
C	N	C	O	C	2-пиридил	Me
C	N	C	O	C	2-пиридил	Et
C	N	C	O	C	2-пиридил	n-Hex
C	N	C	O	C	2-пиридил	c-Pr
C	N	C	O	C	2-пиридил	c-Hex
C	N	C	O	C	2-пиридил	OH
C	N	C	O	C	2-пиридил	CH ₂ OH
C	N	C	O	C	2-пиридил	OMe
C	N	C	O	C	2-пиридил	SMe
C	N	C	O	C	2-пиридил	Cl
C	N	C	O	C	2-пиридил	CF ₃
C	N	C	O	C	2-пиридил	Ph
C	N	C	O	C	3-пиридил	H
C	N	C	O	C	3-пиридил	Me
C	N	C	O	C	3-пиридил	Et
C	N	C	O	C	3-пиридил	n-Hex
C	N	C	O	C	3-пиридил	c-Pr
C	N	C	O	C	3-пиридил	c-Hex
C	N	C	O	C	3-пиридил	OH
C	N	C	O	C	3-пиридил	CH ₂ OH
C	N	C	O	C	3-пиридил	OMe
C	N	C	O	C	3-пиридил	SMe
C	N	C	O	C	3-пиридил	Cl
C	N	C	O	C	3-пиридил	CF ₃
C	N	C	O	C	3-пиридил	Ph
C	N	C	O	C	4-пиридил	H
C	N	C	O	C	4-пиридил	Me
C	N	C	O	C	4-пиридил	Et

RU 2125053 C1

RU 2125053 C1

Таблица 4 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b
C	N	C	O	C	4-пиридил	n-Hex
C	N	C	O	C	4-пиридил	c-Pr
C	N	C	O	C	4-пиридил	c-Hex
C	N	C	O	C	4-пиридил	OH
C	N	C	O	C	4-пиридил	CH ₂ OH
C	N	C	O	C	4-пиридил	OMe
C	N	C	O	C	4-пиридил	SMe
C	N	C	O	C	4-пиридил	Cl
C	N	C	O	C	4-пиридил	CF ₃
C	N	C	O	C	4-пиридил	Ph
C	N	C	O	C	2-фуранил	H
C	N	C	O	C	2-фуранил	Me
C	N	C	O	C	2-фуранил	Et
C	N	C	O	C	2-фуранил	n-Hex
C	N	C	O	C	2-фуранил	c-Pr
C	N	C	O	C	2-фуранил	c-Hex
C	N	C	O	C	2-фуранил	OH
C	N	C	O	C	2-фуранил	CH ₂ OH
C	N	C	O	C	2-фуранил	OMe
C	N	C	O	C	2-фуранил	SMe
C	N	C	O	C	2-фуранил	Cl
C	N	C	O	C	2-фуранил	CF ₃
C	N	C	O	C	2-фуранил	Ph
C	N	C	O	C	2-тиенил	H
C	N	C	O	C	2-тиенил	Me
C	N	C	O	C	2-тиенил	Et
C	N	C	O	C	2-тиенил	n-Hex
C	N	C	O	C	2-тиенил	c-Pr
C	N	C	O	C	2-тиенил	c-Hex
C	N	C	O	C	2-тиенил	OH
C	N	C	O	C	2-тиенил	CH ₂ OH
C	N	C	O	C	2-тиенил	OMe
C	N	C	O	C	2-тиенил	SMe
C	N	C	O	C	2-тиенил	Cl
C	N	C	O	C	2-тиенил	CF ₃
C	N	C	O	C	2-тиенил	Ph
C	N	C	O	C	2-толил	H
C	N	C	O	C	2-толил	Me
C	N	C	O	C	2-толил	Et
C	N	C	O	C	2-толил	n-Hex
C	N	C	O	C	2-толил	c-Pr
C	N	C	O	C	2-толил	c-Hex
C	N	C	O	C	2-толил	OH
C	N	C	O	C	2-толил	CH ₂ OH

RU 2125053 C1

RU 2125053 C1

Таблица 4 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b
C	N	C	O	C	2-ТОЛИЛ	OMe
C	N	C	O	C	2-ТОЛИЛ	SMe
C	N	C	O	C	2-ТОЛИЛ	Cl
C	N	C	O	C	2-ТОЛИЛ	CF ₃
C	N	C	O	C	2-ТОЛИЛ	Ph
C	N	C	O	C	3-ТОЛИЛ	H
C	N	C	O	C	3-ТОЛИЛ	Me
C	N	C	O	C	3-ТОЛИЛ	Et
C	N	C	O	C	3-ТОЛИЛ	n-Hex
C	N	C	O	C	3-ТОЛИЛ	c-Pr
C	N	C	O	C	3-ТОЛИЛ	c-Hex
C	N	C	O	C	3-ТОЛИЛ	OH
C	N	C	O	C	3-ТОЛИЛ	CH ₂ OH
C	N	C	O	C	3-ТОЛИЛ	OMe
C	N	C	O	C	3-ТОЛИЛ	SMe
C	N	C	O	C	3-ТОЛИЛ	Cl
C	N	C	O	C	3-ТОЛИЛ	CF ₃
C	N	C	O	C	3-ТОЛИЛ	Ph
C	N	C	O	C	4-ТОЛИЛ	H
C	N	C	O	C	4-ТОЛИЛ	Me
C	N	C	O	C	4-ТОЛИЛ	Et
C	N	C	O	C	4-ТОЛИЛ	n-Hex
C	N	C	O	C	4-ТОЛИЛ	c-Pr
C	N	C	O	C	4-ТОЛИЛ	c-Hex
C	N	C	O	C	4-ТОЛИЛ	OH
C	N	C	O	C	4-ТОЛИЛ	CH ₂ OH
C	N	C	O	C	4-ТОЛИЛ	OMe
C	N	C	O	C	4-ТОЛИЛ	SMe
C	N	C	O	C	4-ТОЛИЛ	Cl
C	N	C	O	C	4-ТОЛИЛ	CF ₃
C	N	C	O	C	4-ТОЛИЛ	Ph
C	N	C	O	C	Ph-2,3-Me ₂	H
C	N	C	O	C	Ph-2,3-Me ₂	Me
C	N	C	O	C	Ph-2,3-Me ₂	Et
C	N	C	O	C	Ph-2,3-Me ₂	n-Hex
C	N	C	O	C	Ph-2,3-Me ₂	c-Pr
C	N	C	O	C	Ph-2,3-Me ₂	c-Hex
C	N	C	O	C	Ph-2,3-Me ₂	OH
C	N	C	O	C	Ph-2,3-Me ₂	CH ₂ OH
C	N	C	O	C	Ph-2,3-Me ₂	OMe
C	N	C	O	C	Ph-2,3-Me ₂	SMe
C	N	C	O	C	Ph-2,3-Me ₂	Cl
C	N	C	O	C	Ph-2,3-Me ₂	CF ₃
C	N	C	O	C	Ph-2,3-Me ₂	Ph

RU 2125053 C1

RU 2125053 C1

Таблица 4 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b
C	N	C	O	C	Ph-3,4-Me ₂	H
C	N	C	O	C	Ph-3,4-Me ₂	Me
C	N	C	O	C	Ph-3,4-Me ₂	Et
C	N	C	O	C	Ph-3,4-Me ₂	n-Hex
C	N	C	O	C	Ph-3,4-Me ₂	c-Pr
C	N	C	O	C	Ph-3,4-Me ₂	c-Hex
C	N	C	O	C	Ph-3,4-Me ₂	OH
C	N	C	O	C	Ph-3,4-Me ₂	CH ₂ OH
C	N	C	O	C	Ph-3,4-Me ₂	OMe
C	N	C	O	C	Ph-3,4-Me ₂	SMe
C	N	C	O	C	Ph-3,4-Me ₂	Cl
C	N	C	O	C	Ph-3,4-Me ₂	CF ₃
C	N	C	O	C	Ph-3,4-Me ₂	Ph
C	N	C	O	C	Ph-3,5-Me ₂	H
C	N	C	O	C	Ph-3,5-Me ₂	Me
C	N	C	O	C	Ph-3,5-Me ₂	Et
C	N	C	O	C	Ph-3,5-Me ₂	n-Hex
C	N	C	O	C	Ph-3,5-Me ₂	c-Pr
C	N	C	O	C	Ph-3,5-Me ₂	c-Hex
C	N	C	O	C	Ph-3,5-Me ₂	OH
C	N	C	O	C	Ph-3,5-Me ₂	CH ₂ OH
C	N	C	O	C	Ph-3,5-Me ₂	OMe
C	N	C	O	C	Ph-3,5-Me ₂	SMe
C	N	C	O	C	Ph-3,5-Me ₂	Cl
C	N	C	O	C	Ph-3,5-Me ₂	CF ₃
C	N	C	O	C	Ph-3,5-Me ₂	Ph
C	N	C	O	C	Ph-2,6-Me ₂	H
C	N	C	O	C	Ph-2,6-Me ₂	Me
C	N	C	O	C	Ph-2,6-Me ₂	Et
C	N	C	O	C	Ph-2,6-Me ₂	n-Hex
C	N	C	O	C	Ph-2,6-Me ₂	c-Pr
C	N	C	O	C	Ph-2,6-Me ₂	c-Hex
C	N	C	O	C	Ph-2,6-Me ₂	OH
C	N	C	O	C	Ph-2,6-Me ₂	CH ₂ OH
C	N	C	O	C	Ph-2,6-Me ₂	OMe
C	N	C	O	C	Ph-2,6-Me ₂	SMe
C	N	C	O	C	Ph-2,6-Me ₂	Cl
C	N	C	O	C	Ph-2,6-Me ₂	CF ₃
C	N	C	O	C	Ph-2,6-Me ₂	Ph
C	N	C	O	C	Ph-2-Cl	H
C	N	C	O	C	Ph-2-Cl	Me
C	N	C	O	C	Ph-2-Cl	Et
C	N	C	O	C	Ph-2-Cl	n-Hex
C	N	C	O	C	Ph-2-Cl	c-Pr

RU 2125053 C1

RU 2125053 C1

Таблица 4 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b
C	N	C	O	C	Ph-2-Cl	c-Hex
C	N	C	O	C	Ph-2-Cl	OH
C	N	C	O	C	Ph-2-Cl	CH ₂ OH
C	N	C	O	C	Ph-2-Cl	OMe
C	N	C	O	C	Ph-2-Cl	SMe
C	N	C	O	C	Ph-2-Cl	Cl
C	N	C	O	C	Ph-2-Cl	CF ₃
C	N	C	O	C	Ph-2-Cl	Ph
C	N	C	O	C	Ph-3-Cl	H
C	N	C	O	C	Ph-3-Cl	Me
C	N	C	O	C	Ph-3-Cl	Et
C	N	C	O	C	Ph-3-Cl	n-Hex
C	N	C	O	C	Ph-3-Cl	c-Pr
C	N	C	O	C	Ph-3-Cl	c-Hex
C	N	C	O	C	Ph-3-Cl	OH
C	N	C	O	C	Ph-3-Cl	CH ₂ OH
C	N	C	O	C	Ph-3-Cl	OMe
C	N	C	O	C	Ph-3-Cl	SMe
C	N	C	O	C	Ph-3-Cl	Cl
C	N	C	O	C	Ph-3-Cl	CF ₃
C	N	C	O	C	Ph-3-Cl	Ph
C	N	C	O	C	Ph-4-Cl	H
C	N	C	O	C	Ph-4-Cl	Me
C	N	C	O	C	Ph-4-Cl	Et
C	N	C	O	C	Ph-4-Cl	n-Hex
C	N	C	O	C	Ph-4-Cl	c-Pr
C	N	C	O	C	Ph-4-Cl	c-Hex
C	N	C	O	C	Ph-4-Cl	OH
C	N	C	O	C	Ph-4-Cl	CH ₂ OH
C	N	C	O	C	Ph-4-Cl	OMe
C	N	C	O	C	Ph-4-Cl	SMe
C	N	C	O	C	Ph-4-Cl	Cl
C	N	C	O	C	Ph-4-Cl	CF ₃
C	N	C	O	C	Ph-4-Cl	Ph
C	N	C	O	C	Ph-3,4-Cl ₂	H
C	N	C	O	C	Ph-3,4-Cl ₂	Me
C	N	C	O	C	Ph-3,4-Cl ₂	Et
C	N	C	O	C	Ph-3,4-Cl ₂	n-Hex
C	N	C	O	C	Ph-3,4-Cl ₂	c-Pr
C	N	C	O	C	Ph-3,4-Cl ₂	c-Hex
C	N	C	O	C	Ph-3,4-Cl ₂	OH
C	N	C	O	C	Ph-3,4-Cl ₂	CH ₂ OH
C	N	C	O	C	Ph-3,4-Cl ₂	OMe
C	N	C	O	C	Ph-3,4-Cl ₂	SMe

RU 2125053 C1

RU 2125053 C1

RU 2125053 C1

Таблица 4 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b
C	N	C	O	C	Ph-3,4-Cl ₂	Cl
C	N	C	O	C	Ph-3,4-Cl ₂	CF ₃
C	N	C	O	C	Ph-3,4-Cl ₂	Ph
C	N	C	O	C	Ph-4-F	H
C	N	C	O	C	Ph-4-F	Me
C	N	C	O	C	Ph-4-F	Et
C	N	C	O	C	Ph-4-F	n-Hex
C	N	C	O	C	Ph-4-F	c-Pr
C	N	C	O	C	Ph-4-F	c-Hex
C	N	C	O	C	Ph-4-F	OH
C	N	C	O	C	Ph-4-F	CH ₂ OH
C	N	C	O	C	Ph-4-F	OMe
C	N	C	O	C	Ph-4-F	SMe
C	N	C	O	C	Ph-4-F	Cl
C	N	C	O	C	Ph-4-F	CF ₃
C	N	C	O	C	Ph-4-F	Ph
C	N	C	O	C	Ph-4-Br	H
C	N	C	O	C	Ph-4-Br	Me
C	N	C	O	C	Ph-4-Br	Et
C	N	C	O	C	Ph-4-Br	n-Hex
C	N	C	O	C	Ph-4-Br	c-Pr
C	N	C	O	C	Ph-4-Br	c-Hex
C	N	C	O	C	Ph-4-Br	OH
C	N	C	O	C	Ph-4-Br	CH ₂ OH
C	N	C	O	C	Ph-4-Br	OMe
C	N	C	O	C	Ph-4-Br	SMe
C	N	C	O	C	Ph-4-Br	Cl
C	N	C	O	C	Ph-4-Br	CF ₃
C	N	C	O	C	Ph-4-Br	Ph
C	N	C	O	C	Ph-2-OMe	H
C	N	C	O	C	Ph-2-OMe	Me
C	N	C	O	C	Ph-2-OMe	Et
C	N	C	O	C	Ph-2-OMe	n-Hex
C	N	C	O	C	Ph-2-OMe	c-Pr
C	N	C	O	C	Ph-2-OMe	c-Hex
C	N	C	O	C	Ph-2-OMe	OH
C	N	C	O	C	Ph-2-OMe	CH ₂ OH
C	N	C	O	C	Ph-2-OMe	OMe
C	N	C	O	C	Ph-2-OMe	SMe
C	N	C	O	C	Ph-2-OMe	Cl
C	N	C	O	C	Ph-2-OMe	CF ₃
C	N	C	O	C	Ph-2-OMe	Ph
C	N	C	O	C	Ph-3-OMe	H
C	N	C	O	C	Ph-3-OMe	Me

RU 2125053 C1

Таблица 4 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b
C	N	C	O	C	Ph-3-OMe	Et
C	N	C	O	C	Ph-3-OMe	n-Hex
C	N	C	O	C	Ph-3-OMe	c-Pr
C	N	C	O	C	Ph-3-OMe	c-Hex
C	N	C	O	C	Ph-3-OMe	OH
C	N	C	O	C	Ph-3-OMe	CH ₂ OH
C	N	C	O	C	Ph-3-OMe	OMe
C	N	C	O	C	Ph-3-OMe	SMe
C	N	C	O	C	Ph-3-OMe	Cl
C	N	C	O	C	Ph-3-OMe	CF ₃
C	N	C	O	C	Ph-3-OMe	Ph
C	N	C	O	C	Ph-4-OMe	H
C	N	C	O	C	Ph-4-OMe	Me
C	N	C	O	C	Ph-4-OMe	Et
C	N	C	O	C	Ph-4-OMe	n-Hex
C	N	C	O	C	Ph-4-OMe	c-Pr
C	N	C	O	C	Ph-4-OMe	c-Hex
C	N	C	O	C	Ph-4-OMe	OH
C	N	C	O	C	Ph-4-OMe	CH ₂ OH
C	N	C	O	C	Ph-4-OMe	OMe
C	N	C	O	C	Ph-4-OMe	SMe
C	N	C	O	C	Ph-4-OMe	Cl
C	N	C	O	C	Ph-4-OMe	CF ₃
C	N	C	O	C	Ph-4-OMe	Ph
C	N	C	O	C	Ph-3,4-(OMe) ₂	H
C	N	C	O	C	Ph-3,4-(OMe) ₂	Me
C	N	C	O	C	Ph-3,4-(OMe) ₂	Et
C	N	C	O	C	Ph-3,4-(OMe) ₂	n-Hex
C	N	C	O	C	Ph-3,4-(OMe) ₂	c-Pr
C	N	C	O	C	Ph-3,4-(OMe) ₂	c-Hex
C	N	C	O	C	Ph-3,4-(OMe) ₂	OH
C	N	C	O	C	Ph-3,4-(OMe) ₂	CH ₂ OH
C	N	C	O	C	Ph-3,4-(OMe) ₂	OMe
C	N	C	O	C	Ph-3,4-(OMe) ₂	SMe
C	N	C	O	C	Ph-3,4-(OMe) ₂	Cl
C	N	C	O	C	Ph-3,4-(OMe) ₂	CF ₃
C	N	C	O	C	Ph-3,4-(OMe) ₂	Ph
C	N	C	O	C	Ph-2-OH	H
C	N	C	O	C	Ph-2-OH	Me
C	N	C	O	C	Ph-2-OH	Et
C	N	C	O	C	Ph-2-OH	n-Hex
C	N	C	O	C	Ph-2-OH	c-Pr
C	N	C	O	C	Ph-2-OH	c-Hex
C	N	C	O	C	Ph-2-OH	OH

Таблица 4 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b
C	N	C	O	C	Ph-2-OH	CH ₂ OH
C	N	C	O	C	Ph-2-OH	OMe
C	N	C	O	C	Ph-2-OH	SMe
C	N	C	O	C	Ph-2-OH	Cl
C	N	C	O	C	Ph-2-OH	CF ₃
C	N	C	O	C	Ph-2-OH	Ph
C	N	C	O	C	Ph-3-OH	H
C	N	C	O	C	Ph-3-OH	Me
C	N	C	O	C	Ph-3-OH	Et
C	N	C	O	C	Ph-3-OH	n-Hex
C	N	C	O	C	Ph-3-OH	c-Pr
C	N	C	O	C	Ph-3-OH	c-Hex
C	N	C	O	C	Ph-3-OH	OH
C	N	C	O	C	Ph-3-OH	CH ₂ OH
C	N	C	O	C	Ph-3-OH	OMe
C	N	C	O	C	Ph-3-OH	SMe
C	N	C	O	C	Ph-3-OH	Cl
C	N	C	O	C	Ph-3-OH	CF ₃
C	N	C	O	C	Ph-3-OH	Ph
C	N	C	O	C	Ph-4-OH	H
C	N	C	O	C	Ph-4-OH	Me
C	N	C	O	C	Ph-4-OH	Et
C	N	C	O	C	Ph-4-OH	n-Hex
C	N	C	O	C	Ph-4-OH	c-Pr
C	N	C	O	C	Ph-4-OH	c-Hex
C	N	C	O	C	Ph-4-OH	OH
C	N	C	O	C	Ph-4-OH	CH ₂ OH
C	N	C	O	C	Ph-4-OH	OMe
C	N	C	O	C	Ph-4-OH	SMe
C	N	C	O	C	Ph-4-OH	Cl
C	N	C	O	C	Ph-4-OH	CF ₃
C	N	C	O	C	Ph-4-OH	Ph
C	N	C	O	C	Ph-3,4-(OH) ₂	H
C	N	C	O	C	Ph-3,4-(OH) ₂	Me
C	N	C	O	C	Ph-3,4-(OH) ₂	Et
C	N	C	O	C	Ph-3,4-(OH) ₂	n-Hex
C	N	C	O	C	Ph-3,4-(OH) ₂	c-Pr
C	N	C	O	C	Ph-3,4-(OH) ₂	c-Hex
C	N	C	O	C	Ph-3,4-(OH) ₂	OH
C	N	C	O	C	Ph-3,4-(OH) ₂	CH ₂ OH
C	N	C	O	C	Ph-3,4-(OH) ₂	OMe
C	N	C	O	C	Ph-3,4-(OH) ₂	SMe
C	N	C	O	C	Ph-3,4-(OH) ₂	Cl
C	N	C	O	C	Ph-3,4-(OH) ₂	CF ₃

RU 2125053 C1

RU 2125053 C1

Таблица 4 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b
C	N	C	O	C	Ph-3,4-(OH) ₂	Ph
C	N	C	O	C	Ph-3-SMe	H
C	N	C	O	C	Ph-3-SMe	Me
C	N	C	O	C	Ph-3-SMe	Et
C	N	C	O	C	Ph-3-SMe	n-Hex
C	N	C	O	C	Ph-3-SMe	c-Pr
C	N	C	O	C	Ph-3-SMe	c-Hex
C	N	C	O	C	Ph-3-SMe	OH
C	N	C	O	C	Ph-3-SMe	CH ₂ OH
C	N	C	O	C	Ph-3-SMe	OMe
C	N	C	O	C	Ph-3-SMe	SMe
C	N	C	O	C	Ph-3-SMe	Cl
C	N	C	O	C	Ph-3-SMe	CF ₃
C	N	C	O	C	Ph-3-SMe	Ph
C	N	C	O	C	Ph-3-CF ₃	H
C	N	C	O	C	Ph-3-CF ₃	Me
C	N	C	O	C	Ph-3-CF ₃	Et
C	N	C	O	C	Ph-3-CF ₃	n-Hex
C	N	C	O	C	Ph-3-CF ₃	c-Pr
C	N	C	O	C	Ph-3-CF ₃	c-Hex
C	N	C	O	C	Ph-3-CF ₃	OH
C	N	C	O	C	Ph-3-CF ₃	CH ₂ OH
C	N	C	O	C	Ph-3-CF ₃	OMe
C	N	C	O	C	Ph-3-CF ₃	SMe
C	N	C	O	C	Ph-3-CF ₃	Cl
C	N	C	O	C	Ph-3-CF ₃	CF ₃
C	N	C	O	C	Ph-3-CF ₃	Ph
C	N	C	O	C	Ph-3-NO ₂	H
C	N	C	O	C	Ph-3-NO ₂	Me
C	N	C	O	C	Ph-3-NO ₂	Et
C	N	C	O	C	Ph-3-NO ₂	n-Hex
C	N	C	O	C	Ph-3-NO ₂	c-Pr
C	N	C	O	C	Ph-3-NO ₂	c-Hex
C	N	C	O	C	Ph-3-NO ₂	OH
C	N	C	O	C	Ph-3-NO ₂	CH ₂ OH
C	N	C	O	C	Ph-3-NO ₂	OMe
C	N	C	O	C	Ph-3-NO ₂	SMe
C	N	C	O	C	Ph-3-NO ₂	Cl
C	N	C	O	C	Ph-3-NO ₂	CF ₃
C	N	C	O	C	Ph-3-NO ₂	Ph
C	N	C	O	C	Ph-4-NMe ₂	H
C	N	C	O	C	Ph-4-NMe ₂	Me
C	N	C	O	C	Ph-4-NMe ₂	Et
C	N	C	O	C	Ph-4-NMe ₂	n-Hex

RU 2125053 C1

RU 2125053 C1

Таблица 4 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b
C	N	C	O	C	Ph-4-NMe ₂	c-Pr
C	N	C	O	C	Ph-4-NMe ₂	c-Hex
C	N	C	O	C	Ph-4-NMe ₂	OH
C	N	C	O	C	Ph-4-NMe ₂	CH ₂ OH
C	N	C	O	C	Ph-4-NMe ₂	OMe
C	N	C	O	C	Ph-4-NMe ₂	SMe
C	N	C	O	C	Ph-4-NMe ₂	Cl
C	N	C	O	C	Ph-4-NMe ₂	CF ₃
C	N	C	O	C	Ph-4-NMe ₂	Ph
C	N	C	S	C	Ph	H
C	N	C	S	C	Ph	Me
C	N	C	S	C	Ph	Et
C	N	C	S	C	Ph	n-Hex
C	N	C	S	C	Ph	c-Pr
C	N	C	S	C	Ph	c-Hex
C	N	C	S	C	Ph	OH
C	N	C	S	C	Ph	CH ₂ OH
C	N	C	S	C	Ph	OMe
C	N	C	S	C	Ph	SMe
C	N	C	S	C	Ph	Cl
C	N	C	S	C	Ph	CF ₃
C	N	C	S	C	Ph	Ph
C	N	C	S	C	H	H
C	N	C	S	C	H	Me
C	N	C	S	C	H	Et
C	N	C	S	C	H	n-Hex
C	N	C	S	C	H	c-Pr
C	N	C	S	C	H	c-Hex
C	N	C	S	C	H	OH
C	N	C	S	C	H	CH ₂ OH
C	N	C	S	C	H	OMe
C	N	C	S	C	H	SMe
C	N	C	S	C	H	Cl
C	N	C	S	C	H	CF ₃
C	N	C	S	C	H	Ph
C	N	C	S	C	Me	H
C	N	C	S	C	Me	Me
C	N	C	S	C	Me	Et
C	N	C	S	C	Me	n-Hex
C	N	C	S	C	Me	c-Pr
C	N	C	S	C	Me	c-Hex
C	N	C	S	C	Me	OH
C	N	C	S	C	Me	CH ₂ OH
C	N	C	S	C	Me	OMe

RU 2125053 C1

RU 2125053 C1

Таблица 4 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b
C	N	C	S	C	Me	SMe
C	N	C	S	C	Me	Cl
C	N	C	S	C	Me	CF ₃
C	N	C	S	C	Me	Ph
C	N	C	S	C	Et	H
C	N	C	S	C	Et	Me
C	N	C	S	C	Et	Et
C	N	C	S	C	Et	n-Hex
C	N	C	S	C	Et	c-Pr
C	N	C	S	C	Et	c-Hex
C	N	C	S	C	Et	OH
C	N	C	S	C	Et	CH ₂ OH
C	N	C	S	C	Et	OMe
C	N	C	S	C	Et	SMe
C	N	C	S	C	Et	Cl
C	N	C	S	C	Et	CF ₃
C	N	C	S	C	Et	Ph
C	N	C	S	C	n-Pr	H
C	N	C	S	C	n-Pr	Me
C	N	C	S	C	n-Pr	Et
C	N	C	S	C	n-Pr	n-Hex
C	N	C	S	C	n-Pr	c-Pr
C	N	C	S	C	n-Pr	c-Hex
C	N	C	S	C	n-Pr	OH
C	N	C	S	C	n-Pr	CH ₂ OH
C	N	C	S	C	n-Pr	OMe
C	N	C	S	C	n-Pr	SMe
C	N	C	S	C	n-Pr	Cl
C	N	C	S	C	n-Pr	CF ₃
C	N	C	S	C	n-Pr	Ph
C	N	C	S	C	n-Hex	H
C	N	C	S	C	n-Hex	Me
C	N	C	S	C	n-Hex	Et
C	N	C	S	C	n-Hex	n-Hex
C	N	C	S	C	n-Hex	c-Pr
C	N	C	S	C	n-Hex	c-Hex
C	N	C	S	C	n-Hex	OH
C	N	C	S	C	n-Hex	CH ₂ OH
C	N	C	S	C	n-Hex	OMe
C	N	C	S	C	n-Hex	SMe
C	N	C	S	C	n-Hex	Cl
C	N	C	S	C	n-Hex	CF ₃
C	N	C	S	C	n-Hex	Ph
C	N	C	S	C	i-Pr	H

RU 2125053 C1

RU 2125053 C1

Таблица 4 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b
C	N	C	S	C	i-Pr	Me
C	N	C	S	C	i-Pr	Et
C	N	C	S	C	i-Pr	n-Hex
C	N	C	S	C	i-Pr	c-Pr
C	N	C	S	C	i-Pr	c-Hex
C	N	C	S	C	i-Pr	OH
C	N	C	S	C	i-Pr	CH ₂ OH
C	N	C	S	C	i-Pr	OMe
C	N	C	S	C	i-Pr	SMe
C	N	C	S	C	i-Pr	Cl
C	N	C	S	C	i-Pr	CF ₃
C	N	C	S	C	i-Pr	Ph
C	N	C	S	C	t-Bu	H
C	N	C	S	C	t-Bu	Me
C	N	C	S	C	t-Bu	Et
C	N	C	S	C	t-Bu	n-Hex
C	N	C	S	C	t-Bu	c-Pr
C	N	C	S	C	t-Bu	c-Hex
C	N	C	S	C	t-Bu	OH
C	N	C	S	C	t-Bu	CH ₂ OH
C	N	C	S	C	t-Bu	OMe
C	N	C	S	C	t-Bu	SMe
C	N	C	S	C	t-Bu	Cl
C	N	C	S	C	t-Bu	CF ₃
C	N	C	S	C	t-Bu	Ph
C	N	C	S	C	c-Hex	H
C	N	C	S	C	c-Hex	Me
C	N	C	S	C	c-Hex	Et
C	N	C	S	C	c-Hex	n-Hex
C	N	C	S	C	c-Hex	c-Pr
C	N	C	S	C	c-Hex	c-Hex
C	N	C	S	C	c-Hex	OH
C	N	C	S	C	c-Hex	CH ₂ OH
C	N	C	S	C	c-Hex	OMe
C	N	C	S	C	c-Hex	SMe
C	N	C	S	C	c-Hex	Cl
C	N	C	S	C	c-Hex	CF ₃
C	N	C	S	C	c-Hex	Ph
C	N	C	S	C	3-ц-гексенил	H
C	N	C	S	C	3-ц-гексенил	Me
C	N	C	S	C	3-ц-гексенил	Et
C	N	C	S	C	3-ц-гексенил	n-Hex
C	N	C	S	C	3-ц-гексенил	c-Pr
C	N	C	S	C	3-ц-гексенил	c-Hex

RU 2 1 2 5 0 5 3 C 1

RU 2 1 2 5 0 5 3 C 1

Таблица 4 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b
C	N	C	S	C	3-ц-гексенил	ОН
C	N	C	S	C	3-ц-гексенил	CH ₂ ОН
C	N	C	S	C	3-ц-гексенил	OMe
C	N	C	S	C	3-ц-гексенил	SMe
C	N	C	S	C	3-ц-гексенил	Cl
C	N	C	S	C	3-ц-гексенил	CF ₃
C	N	C	S	C	3-ц-гексенил	Ph
C	N	C	S	C	CH ₂ ОН	H
C	N	C	S	C	CH ₂ ОН	Me
C	N	C	S	C	CH ₂ ОН	Et
C	N	C	S	C	CH ₂ ОН	n-Hex
C	N	C	S	C	CH ₂ ОН	c-Pr
C	N	C	S	C	CH ₂ ОН	c-Hex
C	N	C	S	C	CH ₂ ОН	ОН
C	N	C	S	C	CH ₂ ОН	CH ₂ ОН
C	N	C	S	C	CH ₂ ОН	OMe
C	N	C	S	C	CH ₂ ОН	SMe
C	N	C	S	C	CH ₂ ОН	Cl
C	N	C	S	C	CH ₂ ОН	CF ₃
C	N	C	S	C	CH ₂ ОН	Ph
C	N	C	S	C	CH ₂ Ph	H
C	N	C	S	C	CH ₂ Ph	Me
C	N	C	S	C	CH ₂ Ph	Et
C	N	C	S	C	CH ₂ Ph	n-Hex
C	N	C	S	C	CH ₂ Ph	c-Pr
C	N	C	S	C	CH ₂ Ph	c-Hex
C	N	C	S	C	CH ₂ Ph	ОН
C	N	C	S	C	CH ₂ Ph	CH ₂ ОН
C	N	C	S	C	CH ₂ Ph	OMe
C	N	C	S	C	CH ₂ Ph	SMe
C	N	C	S	C	CH ₂ Ph	Cl
C	N	C	S	C	CH ₂ Ph	CF ₃
C	N	C	S	C	CH ₂ Ph	Ph
C	N	C	S	C	α-нафтил	H
C	N	C	S	C	α-нафтил	Me
C	N	C	S	C	α-нафтил	Et
C	N	C	S	C	α-нафтил	n-Hex
C	N	C	S	C	α-нафтил	c-Pr
C	N	C	S	C	α-нафтил	c-Hex
C	N	C	S	C	α-нафтил	ОН
C	N	C	S	C	α-нафтил	CH ₂ ОН
C	N	C	S	C	α-нафтил	OMe
C	N	C	S	C	α-нафтил	SMe
C	N	C	S	C	α-нафтил	Cl

RU 2125053 C1

RU 2125053 C1

Таблица 4 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b
C	N	C	S	C	α -нафтил	CF ₃
C	N	C	S	C	α -нафтил	Ph
C	N	C	S	C	β -нафтил	H
C	N	C	S	C	β -нафтил	Me
C	N	C	S	C	β -нафтил	Et
C	N	C	S	C	β -нафтил	n-Hex
C	N	C	S	C	β -нафтил	c-Pr
C	N	C	S	C	β -нафтил	c-Hex
C	N	C	S	C	β -нафтил	OH
C	N	C	S	C	β -нафтил	CH ₂ OH
C	N	C	S	C	β -нафтил	OMe
C	N	C	S	C	β -нафтил	SMe
C	N	C	S	C	β -нафтил	Cl
C	N	C	S	C	β -нафтил	CF ₃
C	N	C	S	C	β -нафтил	Ph
C	N	C	S	C	2-пиридил	H
C	N	C	S	C	2-пиридил	Me
C	N	C	S	C	2-пиридил	Et
C	N	C	S	C	2-пиридил	n-Hex
C	N	C	S	C	2-пиридил	c-Pr
C	N	C	S	C	2-пиридил	c-Hex
C	N	C	S	C	2-пиридил	OH
C	N	C	S	C	2-пиридил	CH ₂ OH
C	N	C	S	C	2-пиридил	OMe
C	N	C	S	C	2-пиридил	SMe
C	N	C	S	C	2-пиридил	Cl
C	N	C	S	C	2-пиридил	CF ₃
C	N	C	S	C	2-пиридил	Ph
C	N	C	S	C	3-пиридил	H
C	N	C	S	C	3-пиридил	Me
C	N	C	S	C	3-пиридил	Et
C	N	C	S	C	3-пиридил	n-Hex
C	N	C	S	C	3-пиридил	c-Pr
C	N	C	S	C	3-пиридил	c-Hex
C	N	C	S	C	3-пиридил	OH
C	N	C	S	C	3-пиридил	CH ₂ OH
C	N	C	S	C	3-пиридил	OMe
C	N	C	S	C	3-пиридил	SMe
C	N	C	S	C	3-пиридил	Cl
C	N	C	S	C	3-пиридил	CF ₃
C	N	C	S	C	3-пиридил	Ph
C	N	C	S	C	4-пиридил	H
C	N	C	S	C	4-пиридил	Me
C	N	C	S	C	4-пиридил	Et

RU 2 1 2 5 0 5 3 C 1

RU 2 1 2 5 0 5 3 C 1

Таблица 4 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b
C	N	C	S	C	4-пиридил	n-Hex
C	N	C	S	C	4-пиридил	c-Pr
C	N	C	S	C	4-пиридил	c-Hex
C	N	C	S	C	4-пиридил	OH
C	N	C	S	C	4-пиридил	CH ₂ OH
C	N	C	S	C	4-пиридил	OMe
C	N	C	S	C	4-пиридил	SMe
C	N	C	S	C	4-пиридил	Cl
C	N	C	S	C	4-пиридил	CF ₃
C	N	C	S	C	4-пиридил	Ph
C	N	C	S	C	2-фуранил	H
C	N	C	S	C	2-фуранил	Me
C	N	C	S	C	2-фуранил	Et
C	N	C	S	C	2-фуранил	n-Hex
C	N	C	S	C	2-фуранил	c-Pr
C	N	C	S	C	2-фуранил	c-Hex
C	N	C	S	C	2-фуранил	OH
C	N	C	S	C	2-фуранил	CH ₂ OH
C	N	C	S	C	2-фуранил	OMe
C	N	C	S	C	2-фуранил	SMe
C	N	C	S	C	2-фуранил	Cl
C	N	C	S	C	2-фуранил	CF ₃
C	N	C	S	C	2-фуранил	Ph
C	N	C	S	C	2-тиенил	H
C	N	C	S	C	2-тиенил	Me
C	N	C	S	C	2-тиенил	Et
C	N	C	S	C	2-тиенил	n-Hex
C	N	C	S	C	2-тиенил	c-Pr
C	N	C	S	C	2-тиенил	c-Hex
C	N	C	S	C	2-тиенил	OH
C	N	C	S	C	2-тиенил	CH ₂ OH
C	N	C	S	C	2-тиенил	OMe
C	N	C	S	C	2-тиенил	SMe
C	N	C	S	C	2-тиенил	Cl
C	N	C	S	C	2-тиенил	CF ₃
C	N	C	S	C	2-тиенил	Ph
C	N	C	S	C	2-толил	H
C	N	C	S	C	2-толил	Me
C	N	C	S	C	2-толил	Et
C	N	C	S	C	2-толил	n-Hex
C	N	C	S	C	2-толил	c-Pr
C	N	C	S	C	2-толил	c-Hex
C	N	C	S	C	2-толил	OH
C	N	C	S	C	2-толил	CH ₂ OH

RU 2125053 C1

RU 2125053 C1

Таблица 4 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b
C	N	C	S	C	2-ТОЛИЛ	OMe
C	N	C	S	C	2-ТОЛИЛ	SMe
C	N	C	S	C	2-ТОЛИЛ	Cl
C	N	C	S	C	2-ТОЛИЛ	CF ₃
C	N	C	S	C	2-ТОЛИЛ	Ph
C	N	C	S	C	3-ТОЛИЛ	H
C	N	C	S	C	3-ТОЛИЛ	Me
C	N	C	S	C	3-ТОЛИЛ	Et
C	N	C	S	C	3-ТОЛИЛ	n-Hex
C	N	C	S	C	3-ТОЛИЛ	c-Pr
C	N	C	S	C	3-ТОЛИЛ	c-Hex
C	N	C	S	C	3-ТОЛИЛ	OH
C	N	C	S	C	3-ТОЛИЛ	CH ₂ OH
C	N	C	S	C	3-ТОЛИЛ	OMe
C	N	C	S	C	3-ТОЛИЛ	SMe
C	N	C	S	C	3-ТОЛИЛ	Cl
C	N	C	S	C	3-ТОЛИЛ	CF ₃
C	N	C	S	C	3-ТОЛИЛ	Ph
C	N	C	S	C	4-ТОЛИЛ	H
C	N	C	S	C	4-ТОЛИЛ	Me
C	N	C	S	C	4-ТОЛИЛ	Et
C	N	C	S	C	4-ТОЛИЛ	n-Hex
C	N	C	S	C	4-ТОЛИЛ	c-Pr
C	N	C	S	C	4-ТОЛИЛ	c-Hex
C	N	C	S	C	4-ТОЛИЛ	OH
C	N	C	S	C	4-ТОЛИЛ	CH ₂ OH
C	N	C	S	C	4-ТОЛИЛ	OMe
C	N	C	S	C	4-ТОЛИЛ	SMe
C	N	C	S	C	4-ТОЛИЛ	Cl
C	N	C	S	C	4-ТОЛИЛ	CF ₃
C	N	C	S	C	4-ТОЛИЛ	Ph
C	N	C	S	C	Ph-2,3-Me ₂	H
C	N	C	S	C	Ph-2,3-Me ₂	Me
C	N	C	S	C	Ph-2,3-Me ₂	Et
C	N	C	S	C	Ph-2,3-Me ₂	n-Hex
C	N	C	S	C	Ph-2,3-Me ₂	c-Pr
C	N	C	S	C	Ph-2,3-Me ₂	c-Hex
C	N	C	S	C	Ph-2,3-Me ₂	OH
C	N	C	S	C	Ph-2,3-Me ₂	CH ₂ OH
C	N	C	S	C	Ph-2,3-Me ₂	OMe
C	N	C	S	C	Ph-2,3-Me ₂	SMe
C	N	C	S	C	Ph-2,3-Me ₂	Cl
C	N	C	S	C	Ph-2,3-Me ₂	CF ₃
C	N	C	S	C	Ph-2,3-Me ₂	Ph

RU 2125053 C1

RU 2125053 C1

Таблица 4 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b
C	N	C	S	C	Ph-3,4-Me ₂	H
C	N	C	S	C	Ph-3,4-Me ₂	Me
C	N	C	S	C	Ph-3,4-Me ₂	Et
C	N	C	S	C	Ph-3,4-Me ₂	n-Hex
C	N	C	S	C	Ph-3,4-Me ₂	c-Pr
C	N	C	S	C	Ph-3,4-Me ₂	c-Hex
C	N	C	S	C	Ph-3,4-Me ₂	OH
C	N	C	S	C	Ph-3,4-Me ₂	CH ₂ OH
C	N	C	S	C	Ph-3,4-Me ₂	OMe
C	N	C	S	C	Ph-3,4-Me ₂	SMe
C	N	C	S	C	Ph-3,4-Me ₂	Cl
C	N	C	S	C	Ph-3,4-Me ₂	CF ₃
C	N	C	S	C	Ph-3,4-Me ₂	Ph
C	N	C	S	C	Ph-3,5-Me ₂	H
C	N	C	S	C	Ph-3,5-Me ₂	Me
C	N	C	S	C	Ph-3,5-Me ₂	Et
C	N	C	S	C	Ph-3,5-Me ₂	n-Hex
C	N	C	S	C	Ph-3,5-Me ₂	c-Pr
C	N	C	S	C	Ph-3,5-Me ₂	c-Hex
C	N	C	S	C	Ph-3,5-Me ₂	OH
C	N	C	S	C	Ph-3,5-Me ₂	CH ₂ OH
C	N	C	S	C	Ph-3,5-Me ₂	OMe
C	N	C	S	C	Ph-3,5-Me ₂	SMe
C	N	C	S	C	Ph-3,5-Me ₂	Cl
C	N	C	S	C	Ph-3,5-Me ₂	CF ₃
C	N	C	S	C	Ph-3,5-Me ₂	Ph
C	N	C	S	C	Ph-2,6-Me ₂	H
C	N	C	S	C	Ph-2,6-Me ₂	Me
C	N	C	S	C	Ph-2,6-Me ₂	Et
C	N	C	S	C	Ph-2,6-Me ₂	n-Hex
C	N	C	S	C	Ph-2,6-Me ₂	c-Pr
C	N	C	S	C	Ph-2,6-Me ₂	c-Hex
C	N	C	S	C	Ph-2,6-Me ₂	OH
C	N	C	S	C	Ph-2,6-Me ₂	CH ₂ OH
C	N	C	S	C	Ph-2,6-Me ₂	OMe
C	N	C	S	C	Ph-2,6-Me ₂	SMe
C	N	C	S	C	Ph-2,6-Me ₂	Cl
C	N	C	S	C	Ph-2,6-Me ₂	CF ₃
C	N	C	S	C	Ph-2,6-Me ₂	Ph
C	N	C	S	C	Ph-2-Cl	H
C	N	C	S	C	Ph-2-Cl	Me
C	N	C	S	C	Ph-2-Cl	Et
C	N	C	S	C	Ph-2-Cl	n-Hex
C	N	C	S	C	Ph-2-Cl	c-Pr

RU 2125053 C1

RU 2125053 C1

Таблица 4 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b
C	N	C	S	C	Ph-2-Cl	c-Hex
C	N	C	S	C	Ph-2-Cl	OH
C	N	C	S	C	Ph-2-Cl	CH ₂ OH
C	N	C	S	C	Ph-2-Cl	OMe
C	N	C	S	C	Ph-2-Cl	SMe
C	N	C	S	C	Ph-2-Cl	Cl
C	N	C	S	C	Ph-2-Cl	CF ₃
C	N	C	S	C	Ph-2-Cl	Ph
C	N	C	S	C	Ph-3-Cl	H
C	N	C	S	C	Ph-3-Cl	Me
C	N	C	S	C	Ph-3-Cl	Et
C	N	C	S	C	Ph-3-Cl	n-Hex
C	N	C	S	C	Ph-3-Cl	c-Pr
C	N	C	S	C	Ph-3-Cl	c-Hex
C	N	C	S	C	Ph-3-Cl	OH
C	N	C	S	C	Ph-3-Cl	CH ₂ OH
C	N	C	S	C	Ph-3-Cl	OMe
C	N	C	S	C	Ph-3-Cl	SMe
C	N	C	S	C	Ph-3-Cl	Cl
C	N	C	S	C	Ph-3-Cl	CF ₃
C	N	C	S	C	Ph-3-Cl	Ph
C	N	C	S	C	Ph-4-Cl	H
C	N	C	S	C	Ph-4-Cl	Me
C	N	C	S	C	Ph-4-Cl	Et
C	N	C	S	C	Ph-4-Cl	n-Hex
C	N	C	S	C	Ph-4-Cl	c-Pr
C	N	C	S	C	Ph-4-Cl	c-Hex
C	N	C	S	C	Ph-4-Cl	OH
C	N	C	S	C	Ph-4-Cl	CH ₂ OH
C	N	C	S	C	Ph-4-Cl	OMe
C	N	C	S	C	Ph-4-Cl	SMe
C	N	C	S	C	Ph-4-Cl	Cl
C	N	C	S	C	Ph-4-Cl	CF ₃
C	N	C	S	C	Ph-4-Cl	Ph
C	N	C	S	C	Ph-3,4-Cl ₂	H
C	N	C	S	C	Ph-3,4-Cl ₂	Me
C	N	C	S	C	Ph-3,4-Cl ₂	Et
C	N	C	S	C	Ph-3,4-Cl ₂	n-Hex
C	N	C	S	C	Ph-3,4-Cl ₂	c-Pr
C	N	C	S	C	Ph-3,4-Cl ₂	c-Hex
C	N	C	S	C	Ph-3,4-Cl ₂	OH
C	N	C	S	C	Ph-3,4-Cl ₂	CH ₂ OH
C	N	C	S	C	Ph-3,4-Cl ₂	OMe
C	N	C	S	C	Ph-3,4-Cl ₂	SMe

RU 2125053 C1

RU 2125053 C1

Таблица 4 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b
C	N	C	S	C	Ph-3,4-Cl ₂	Cl
C	N	C	S	C	Ph-3,4-Cl ₂	CF ₃
C	N	C	S	C	Ph-3,4-Cl ₂	Ph
C	N	C	S	C	Ph-4-F	H
C	N	C	S	C	Ph-4-F	Me
C	N	C	S	C	Ph-4-F	Et
C	N	C	S	C	Ph-4-F	n-Hex
C	N	C	S	C	Ph-4-F	c-Pr
C	N	C	S	C	Ph-4-F	c-Hex
C	N	C	S	C	Ph-4-F	OH
C	N	C	S	C	Ph-4-F	CH ₂ OH
C	N	C	S	C	Ph-4-F	OMe
C	N	C	S	C	Ph-4-F	SMe
C	N	C	S	C	Ph-4-F	Cl
C	N	C	S	C	Ph-4-F	CF ₃
C	N	C	S	C	Ph-4-F	Ph
C	N	C	S	C	Ph-4-Br	H
C	N	C	S	C	Ph-4-Br	Me
C	N	C	S	C	Ph-4-Br	Et
C	N	C	S	C	Ph-4-Br	n-Hex
C	N	C	S	C	Ph-4-Br	c-Pr
C	N	C	S	C	Ph-4-Br	c-Hex
C	N	C	S	C	Ph-4-Br	OH
C	N	C	S	C	Ph-4-Br	CH ₂ OH
C	N	C	S	C	Ph-4-Br	OMe
C	N	C	S	C	Ph-4-Br	SMe
C	N	C	S	C	Ph-4-Br	Cl
C	N	C	S	C	Ph-4-Br	CF ₃
C	N	C	S	C	Ph-4-Br	Ph
C	N	C	S	C	Ph-2-OMe	H
C	N	C	S	C	Ph-2-OMe	Me
C	N	C	S	C	Ph-2-OMe	Et
C	N	C	S	C	Ph-2-OMe	n-Hex
C	N	C	S	C	Ph-2-OMe	c-Pr
C	N	C	S	C	Ph-2-OMe	c-Hex
C	N	C	S	C	Ph-2-OMe	OH
C	N	C	S	C	Ph-2-OMe	CH ₂ OH
C	N	C	S	C	Ph-2-OMe	OMe
C	N	C	S	C	Ph-2-OMe	SMe
C	N	C	S	C	Ph-2-OMe	Cl
C	N	C	S	C	Ph-2-OMe	CF ₃
C	N	C	S	C	Ph-2-OMe	Ph
C	N	C	S	C	Ph-3-OMe	H
C	N	C	S	C	Ph-3-OMe	Me

RU 2125053 C1

RU 2125053 C1

Таблица 4 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b
C	N	C	S	C	Ph-3-OMe	Et
C	N	C	S	C	Ph-3-OMe	n-Hex
C	N	C	S	C	Ph-3-OMe	c-Pr
C	N	C	S	C	Ph-3-OMe	c-Hex
C	N	C	S	C	Ph-3-OMe	OH
C	N	C	S	C	Ph-3-OMe	CH ₂ OH
C	N	C	S	C	Ph-3-OMe	OMe
C	N	C	S	C	Ph-3-OMe	SMe
C	N	C	S	C	Ph-3-OMe	Cl
C	N	C	S	C	Ph-3-OMe	CF ₃
C	N	C	S	C	Ph-3-OMe	Ph
C	N	C	S	C	Ph-4-OMe	H
C	N	C	S	C	Ph-4-OMe	Me
C	N	C	S	C	Ph-4-OMe	Et
C	N	C	S	C	Ph-4-OMe	n-Hex
C	N	C	S	C	Ph-4-OMe	c-Pr
C	N	C	S	C	Ph-4-OMe	c-Hex
C	N	C	S	C	Ph-4-OMe	OH
C	N	C	S	C	Ph-4-OMe	CH ₂ OH
C	N	C	S	C	Ph-4-OMe	OMe
C	N	C	S	C	Ph-4-OMe	SMe
C	N	C	S	C	Ph-4-OMe	Cl
C	N	C	S	C	Ph-4-OMe	CF ₃
C	N	C	S	C	Ph-4-OMe	Ph
C	N	C	S	C	Ph-3,4-(OMe) ₂	H
C	N	C	S	C	Ph-3,4-(OMe) ₂	Me
C	N	C	S	C	Ph-3,4-(OMe) ₂	Et
C	N	C	S	C	Ph-3,4-(OMe) ₂	n-Hex
C	N	C	S	C	Ph-3,4-(OMe) ₂	c-Pr
C	N	C	S	C	Ph-3,4-(OMe) ₂	c-Hex
C	N	C	S	C	Ph-3,4-(OMe) ₂	OH
C	N	C	S	C	Ph-3,4-(OMe) ₂	CH ₂ OH
C	N	C	S	C	Ph-3,4-(OMe) ₂	OMe
C	N	C	S	C	Ph-3,4-(OMe) ₂	SMe
C	N	C	S	C	Ph-3,4-(OMe) ₂	Cl
C	N	C	S	C	Ph-3,4-(OMe) ₂	CF ₃
C	N	C	S	C	Ph-3,4-(OMe) ₂	Ph
C	N	C	S	C	Ph-2-OH	H
C	N	C	S	C	Ph-2-OH	Me
C	N	C	S	C	Ph-2-OH	Et
C	N	C	S	C	Ph-2-OH	n-Hex
C	N	C	S	C	Ph-2-OH	c-Pr
C	N	C	S	C	Ph-2-OH	c-Hex
C	N	C	S	C	Ph-2-OH	OH

RU 2 1 2 5 0 5 3 C 1

RU 2 1 2 5 0 5 3 C 1

Таблица 4 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b
C	N	C	S	C	Ph-2-OH	CH ₂ OH
C	N	C	S	C	Ph-2-OH	OMe
C	N	C	S	C	Ph-2-OH	SMe
C	N	C	S	C	Ph-2-OH	Cl
C	N	C	S	C	Ph-2-OH	CF ₃
C	N	C	S	C	Ph-2-OH	Ph
C	N	C	S	C	Ph-3-OH	H
C	N	C	S	C	Ph-3-OH	Me
C	N	C	S	C	Ph-3-OH	Et
C	N	C	S	C	Ph-3-OH	n-Hex
C	N	C	S	C	Ph-3-OH	c-Pr
C	N	C	S	C	Ph-3-OH	c-Hex
C	N	C	S	C	Ph-3-OH	OH
C	N	C	S	C	Ph-3-OH	CH ₂ OH
C	N	C	S	C	Ph-3-OH	OMe
C	N	C	S	C	Ph-3-OH	SMe
C	N	C	S	C	Ph-3-OH	Cl
C	N	C	S	C	Ph-3-OH	CF ₃
C	N	C	S	C	Ph-3-OH	Ph
C	N	C	S	C	Ph-4-OH	H
C	N	C	S	C	Ph-4-OH	Me
C	N	C	S	C	Ph-4-OH	Et
C	N	C	S	C	Ph-4-OH	n-Hex
C	N	C	S	C	Ph-4-OH	c-Pr
C	N	C	S	C	Ph-4-OH	c-Hex
C	N	C	S	C	Ph-4-OH	OH
C	N	C	S	C	Ph-4-OH	CH ₂ OH
C	N	C	S	C	Ph-4-OH	OMe
C	N	C	S	C	Ph-4-OH	SMe
C	N	C	S	C	Ph-4-OH	Cl
C	N	C	S	C	Ph-4-OH	CF ₃
C	N	C	S	C	Ph-4-OH	Ph
C	N	C	S	C	Ph-3,4-(OH) ₂	H
C	N	C	S	C	Ph-3,4-(OH) ₂	Me
C	N	C	S	C	Ph-3,4-(OH) ₂	Et
C	N	C	S	C	Ph-3,4-(OH) ₂	n-Hex
C	N	C	S	C	Ph-3,4-(OH) ₂	c-Pr
C	N	C	S	C	Ph-3,4-(OH) ₂	c-Hex
C	N	C	S	C	Ph-3,4-(OH) ₂	OH
C	N	C	S	C	Ph-3,4-(OH) ₂	CH ₂ OH
C	N	C	S	C	Ph-3,4-(OH) ₂	OMe
C	N	C	S	C	Ph-3,4-(OH) ₂	SMe
C	N	C	S	C	Ph-3,4-(OH) ₂	Cl
C	N	C	S	C	Ph-3,4-(OH) ₂	CF ₃

RU 2125053 C1

RU 2125053 C1

Таблица 4 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b
C	N	C	S	C	Ph-3,4-(OH) ₂	Ph
C	N	C	S	C	Ph-3-SMe	H
C	N	C	S	C	Ph-3-SMe	Me
C	N	C	S	C	Ph-3-SMe	Et
C	N	C	S	C	Ph-3-SMe	n-Hex
C	N	C	S	C	Ph-3-SMe	c-Pr
C	N	C	S	C	Ph-3-SMe	c-Hex
C	N	C	S	C	Ph-3-SMe	OH
C	N	C	S	C	Ph-3-SMe	CH ₂ OH
C	N	C	S	C	Ph-3-SMe	OMe
C	N	C	S	C	Ph-3-SMe	SMe
C	N	C	S	C	Ph-3-SMe	Cl
C	N	C	S	C	Ph-3-SMe	CF ₃
C	N	C	S	C	Ph-3-SMe	Ph
C	N	C	S	C	Ph-3-CF ₃	H
C	N	C	S	C	Ph-3-CF ₃	Me
C	N	C	S	C	Ph-3-CF ₃	Et
C	N	C	S	C	Ph-3-CF ₃	n-Hex
C	N	C	S	C	Ph-3-CF ₃	c-Pr
C	N	C	S	C	Ph-3-CF ₃	c-Hex
C	N	C	S	C	Ph-3-CF ₃	OH
C	N	C	S	C	Ph-3-CF ₃	CH ₂ OH
C	N	C	S	C	Ph-3-CF ₃	OMe
C	N	C	S	C	Ph-3-CF ₃	SMe
C	N	C	S	C	Ph-3-CF ₃	Cl
C	N	C	S	C	Ph-3-CF ₃	CF ₃
C	N	C	S	C	Ph-3-CF ₃	Ph
C	N	C	S	C	Ph-3-NO ₂	H
C	N	C	S	C	Ph-3-NO ₂	Me
C	N	C	S	C	Ph-3-NO ₂	Et
C	N	C	S	C	Ph-3-NO ₂	n-Hex
C	N	C	S	C	Ph-3-NO ₂	c-Pr
C	N	C	S	C	Ph-3-NO ₂	c-Hex
C	N	C	S	C	Ph-3-NO ₂	OH
C	N	C	S	C	Ph-3-NO ₂	CH ₂ OH
C	N	C	S	C	Ph-3-NO ₂	OMe
C	N	C	S	C	Ph-3-NO ₂	SMe
C	N	C	S	C	Ph-3-NO ₂	Cl
C	N	C	S	C	Ph-3-NO ₂	CF ₃
C	N	C	S	C	Ph-3-NO ₂	Ph
C	N	C	S	C	Ph-4-NMe ₂	H
C	N	C	S	C	Ph-4-NMe ₂	Me
C	N	C	S	C	Ph-4-NMe ₂	Et
C	N	C	S	C	Ph-4-NMe ₂	n-Hex

RU 2125053 C1

RU 2125053 C1

Таблица 4 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b
C	N	C	S	C	Ph-4-NMe ₂	c-Pr
C	N	C	S	C	Ph-4-NMe ₂	c-Hex
C	N	C	S	C	Ph-4-NMe ₂	OH
C	N	C	S	C	Ph-4-NMe ₂	CH ₂ OH
C	N	C	S	C	Ph-4-NMe ₂	OMe
C	N	C	S	C	Ph-4-NMe ₂	SMe
C	N	C	S	C	Ph-4-NMe ₂	Cl
C	N	C	S	C	Ph-4-NMe ₂	CF ₃
C	N	C	S	C	Ph-4-NMe ₂	Ph
C	O	C	N	C	Ph	H
C	O	C	N	C	Ph	Me
C	O	C	N	C	Ph	Et
C	O	C	N	C	Ph	n-Hex
C	O	C	N	C	Ph	c-Pr
C	O	C	N	C	Ph	c-Hex
C	O	C	N	C	Ph	OH
C	O	C	N	C	Ph	CH ₂ OH
C	O	C	N	C	Ph	OMe
C	O	C	N	C	Ph	SMe
C	O	C	N	C	Ph	Cl
C	O	C	N	C	Ph	CF ₃
C	O	C	N	C	Ph	Ph
C	O	C	N	C	H	H
C	O	C	N	C	H	Me
C	O	C	N	C	H	Et
C	O	C	N	C	H	n-Hex
C	O	C	N	C	H	c-Pr
C	O	C	N	C	H	c-Hex
C	O	C	N	C	H	OH
C	O	C	N	C	H	CH ₂ OH
C	O	C	N	C	H	OMe
C	O	C	N	C	H	SMe
C	O	C	N	C	H	Cl
C	O	C	N	C	H	CF ₃
C	O	C	N	C	H	Ph
C	O	C	N	C	Me	H
C	O	C	N	C	Me	Me
C	O	C	N	C	Me	Et
C	O	C	N	C	Me	n-Hex
C	O	C	N	C	Me	c-Pr
C	O	C	N	C	Me	c-Hex
C	O	C	N	C	Me	OH
C	O	C	N	C	Me	CH ₂ OH
C	O	C	N	C	Me	OMe

RU 2125053 C1

RU 2125053 C1

Таблица 4 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b
C	O	C	N	C	Me	SMe
C	O	C	N	C	Me	Cl
C	O	C	N	C	Me	CF ₃
C	O	C	N	C	Me	Ph
C	O	C	N	C	Et	H
C	O	C	N	C	Et	Me
C	O	C	N	C	Et	Et
C	O	C	N	C	Et	n-Hex
C	O	C	N	C	Et	c-Pr
C	O	C	N	C	Et	c-Hex
C	O	C	N	C	Et	OH
C	O	C	N	C	Et	CH ₂ OH
C	O	C	N	C	Et	OMe
C	O	C	N	C	Et	SMe
C	O	C	N	C	Et	Cl
C	O	C	N	C	Et	CF ₃
C	O	C	N	C	Et	Ph
C	O	C	N	C	n-Pr	H
C	O	C	N	C	n-Pr	Me
C	O	C	N	C	n-Pr	Et
C	O	C	N	C	n-Pr	n-Hex
C	O	C	N	C	n-Pr	c-Pr
C	O	C	N	C	n-Pr	c-Hex
C	O	C	N	C	n-Pr	OH
C	O	C	N	C	n-Pr	CH ₂ OH
C	O	C	N	C	n-Pr	OMe
C	O	C	N	C	n-Pr	SMe
C	O	C	N	C	n-Pr	Cl
C	O	C	N	C	n-Pr	CF ₃
C	O	C	N	C	n-Pr	Ph
C	O	C	N	C	n-Hex	H
C	O	C	N	C	n-Hex	Me
C	O	C	N	C	n-Hex	Et
C	O	C	N	C	n-Hex	n-Hex
C	O	C	N	C	n-Hex	c-Pr
C	O	C	N	C	n-Hex	c-Hex
C	O	C	N	C	n-Hex	OH
C	O	C	N	C	n-Hex	CH ₂ OH
C	O	C	N	C	n-Hex	OMe
C	O	C	N	C	n-Hex	SMe
C	O	C	N	C	n-Hex	Cl
C	O	C	N	C	n-Hex	CF ₃
C	O	C	N	C	n-Hex	Ph
C	O	C	N	C	i-Pr	H

RU 2 1 2 5 0 5 3 C 1

RU 2 1 2 5 0 5 3 C 1

Таблица 4 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b
C	O	C	N	C	i-Pr	Me
C	O	C	N	C	i-Pr	Et
C	O	C	N	C	i-Pr	n-Hex
C	O	C	N	C	i-Pr	c-Pr
C	O	C	N	C	i-Pr	c-Hex
C	O	C	N	C	i-Pr	OH
C	O	C	N	C	i-Pr	CH ₂ OH
C	O	C	N	C	i-Pr	OMe
C	O	C	N	C	i-Pr	SMe
C	O	C	N	C	i-Pr	Cl
C	O	C	N	C	i-Pr	CF ₃
C	O	C	N	C	i-Pr	Ph
C	O	C	N	C	t-Bu	H
C	O	C	N	C	t-Bu	Me
C	O	C	N	C	t-Bu	Et
C	O	C	N	C	t-Bu	n-Hex
C	O	C	N	C	t-Bu	c-Pr
C	O	C	N	C	t-Bu	c-Hex
C	O	C	N	C	t-Bu	OH
C	O	C	N	C	t-Bu	CH ₂ OH
C	O	C	N	C	t-Bu	OMe
C	O	C	N	C	t-Bu	SMe
C	O	C	N	C	t-Bu	Cl
C	O	C	N	C	t-Bu	CF ₃
C	O	C	N	C	t-Bu	Ph
C	O	C	N	C	c-Hex	H
C	O	C	N	C	c-Hex	Me
C	O	C	N	C	c-Hex	Et
C	O	C	N	C	c-Hex	n-Hex
C	O	C	N	C	c-Hex	c-Pr
C	O	C	N	C	c-Hex	c-Hex
C	O	C	N	C	c-Hex	OH
C	O	C	N	C	c-Hex	CH ₂ OH
C	O	C	N	C	c-Hex	OMe
C	O	C	N	C	c-Hex	SMe
C	O	C	N	C	c-Hex	Cl
C	O	C	N	C	c-Hex	CF ₃
C	O	C	N	C	c-Hex	Ph
C	O	C	N	C	3-ц-гексенил	H
C	O	C	N	C	3-ц-гексенил	Me
C	O	C	N	C	3-ц-гексенил	Et
C	O	C	N	C	3-ц-гексенил	n-Hex
C	O	C	N	C	3-ц-гексенил	c-Pr
C	O	C	N	C	3-ц-гексенил	c-Hex

RU 2125053 C1

RU 2125053 C1

Таблица 4 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b
C	O	C	N	C	3-Ц-гексенил	ОН
C	O	C	N	C	3-Ц-гексенил	CH ₂ ОН
C	O	C	N	C	3-Ц-гексенил	OMe
C	O	C	N	C	3-Ц-гексенил	SMe
C	O	C	N	C	3-Ц-гексенил	Cl
C	O	C	N	C	3-Ц-гексенил	CF ₃
C	O	C	N	C	3-Ц-гексенил	Ph
C	O	C	N	C	CH ₂ ОН	H
C	O	C	N	C	CH ₂ ОН	Me
C	O	C	N	C	CH ₂ ОН	Et
C	O	C	N	C	CH ₂ ОН	n-Hex
C	O	C	N	C	CH ₂ ОН	c-Pr
C	O	C	N	C	CH ₂ ОН	c-Hex
C	O	C	N	C	CH ₂ ОН	ОН
C	O	C	N	C	CH ₂ ОН	CH ₂ ОН
C	O	C	N	C	CH ₂ ОН	OMe
C	O	C	N	C	CH ₂ ОН	SMe
C	O	C	N	C	CH ₂ ОН	Cl
C	O	C	N	C	CH ₂ ОН	CF ₃
C	O	C	N	C	CH ₂ ОН	Ph
C	O	C	N	C	CH ₂ Ph	H
C	O	C	N	C	CH ₂ Ph	Me
C	O	C	N	C	CH ₂ Ph	Et
C	O	C	N	C	CH ₂ Ph	n-Hex
C	O	C	N	C	CH ₂ Ph	c-Pr
C	O	C	N	C	CH ₂ Ph	c-Hex
C	O	C	N	C	CH ₂ Ph	ОН
C	O	C	N	C	CH ₂ Ph	CH ₂ ОН
C	O	C	N	C	CH ₂ Ph	OMe
C	O	C	N	C	CH ₂ Ph	SMe
C	O	C	N	C	CH ₂ Ph	Cl
C	O	C	N	C	CH ₂ Ph	CF ₃
C	O	C	N	C	CH ₂ Ph	Ph
C	O	C	N	C	α-нафтил	H
C	O	C	N	C	α-нафтил	Me
C	O	C	N	C	α-нафтил	Et
C	O	C	N	C	α-нафтил	n-Hex
C	O	C	N	C	α-нафтил	c-Pr
C	O	C	N	C	α-нафтил	c-Hex
C	O	C	N	C	α-нафтил	ОН
C	O	C	N	C	α-нафтил	CH ₂ ОН
C	O	C	N	C	α-нафтил	OMe
C	O	C	N	C	α-нафтил	SMe
C	O	C	N	C	α-нафтил	Cl

RU 2125053 C1

RU 2125053 C1

Таблица 4 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b
C	O	C	N	C	α -нафтил	CF ₃
C	O	C	N	C	α -нафтил	Ph
C	O	C	N	C	β -нафтил	H
C	O	C	N	C	β -нафтил	Me
C	O	C	N	C	β -нафтил	Et
C	O	C	N	C	β -нафтил	n-Hex
C	O	C	N	C	β -нафтил	c-Pr
C	O	C	N	C	β -нафтил	c-Hex
C	O	C	N	C	β -нафтил	OH
C	O	C	N	C	β -нафтил	CH ₂ OH
C	O	C	N	C	β -нафтил	OMe
C	O	C	N	C	β -нафтил	SMe
C	O	C	N	C	β -нафтил	Cl
C	O	C	N	C	β -нафтил	CF ₃
C	O	C	N	C	β -нафтил	Ph
C	O	C	N	C	2-пиридил	H
C	O	C	N	C	2-пиридил	Me
C	O	C	N	C	2-пиридил	Et
C	O	C	N	C	2-пиридил	n-Hex
C	O	C	N	C	2-пиридил	c-Pr
C	O	C	N	C	2-пиридил	c-Hex
C	O	C	N	C	2-пиридил	OH
C	O	C	N	C	2-пиридил	CH ₂ OH
C	O	C	N	C	2-пиридил	OMe
C	O	C	N	C	2-пиридил	SMe
C	O	C	N	C	2-пиридил	Cl
C	O	C	N	C	2-пиридил	CF ₃
C	O	C	N	C	2-пиридил	Ph
C	O	C	N	C	3-пиридил	H
C	O	C	N	C	3-пиридил	Me
C	O	C	N	C	3-пиридил	Et
C	O	C	N	C	3-пиридил	n-Hex
C	O	C	N	C	3-пиридил	c-Pr
C	O	C	N	C	3-пиридил	c-Hex
C	O	C	N	C	3-пиридил	OH
C	O	C	N	C	3-пиридил	CH ₂ OH
C	O	C	N	C	3-пиридил	OMe
C	O	C	N	C	3-пиридил	SMe
C	O	C	N	C	3-пиридил	Cl
C	O	C	N	C	3-пиридил	CF ₃
C	O	C	N	C	3-пиридил	Ph
C	O	C	N	C	4-пиридил	H
C	O	C	N	C	4-пиридил	Me
C	O	C	N	C	4-пиридил	Et

RU 2125053 C1

RU 2125053 C1

Таблица 4 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b
C	O	C	N	C	4-пиридил	n-Hex
C	O	C	N	C	4-пиридил	c-Pr
C	O	C	N	C	4-пиридил	c-Hex
C	O	C	N	C	4-пиридил	OH
C	O	C	N	C	4-пиридил	CH ₂ OH
C	O	C	N	C	4-пиридил	OMe
C	O	C	N	C	4-пиридил	SMe
C	O	C	N	C	4-пиридил	Cl
C	O	C	N	C	4-пиридил	CF ₃
C	O	C	N	C	4-пиридил	Ph
C	O	C	N	C	2-фуранил	H
C	O	C	N	C	2-фуранил	Me
C	O	C	N	C	2-фуранил	Et
C	O	C	N	C	2-фуранил	n-Hex
C	O	C	N	C	2-фуранил	c-Pr
C	O	C	N	C	2-фуранил	c-Hex
C	O	C	N	C	2-фуранил	OH
C	O	C	N	C	2-фуранил	CH ₂ OH
C	O	C	N	C	2-фуранил	OMe
C	O	C	N	C	2-фуранил	SMe
C	O	C	N	C	2-фуранил	Cl
C	O	C	N	C	2-фуранил	CF ₃
C	O	C	N	C	2-фуранил	Ph
C	O	C	N	C	2-тиенил	H
C	O	C	N	C	2-тиенил	Me
C	O	C	N	C	2-тиенил	Et
C	O	C	N	C	2-тиенил	n-Hex
C	O	C	N	C	2-тиенил	c-Pr
C	O	C	N	C	2-тиенил	c-Hex
C	O	C	N	C	2-тиенил	OH
C	O	C	N	C	2-тиенил	CH ₂ OH
C	O	C	N	C	2-тиенил	OMe
C	O	C	N	C	2-тиенил	SMe
C	O	C	N	C	2-тиенил	Cl
C	O	C	N	C	2-тиенил	CF ₃
C	O	C	N	C	2-тиенил	Ph
C	O	C	N	C	2-толил	H
C	O	C	N	C	2-толил	Me
C	O	C	N	C	2-толил	Et
C	O	C	N	C	2-толил	n-Hex
C	O	C	N	C	2-толил	c-Pr
C	O	C	N	C	2-толил	c-Hex
C	O	C	N	C	2-толил	OH
C	O	C	N	C	2-толил	CH ₂ OH

RU 2 1 2 5 0 5 3 C 1

RU 2 1 2 5 0 5 3 C 1

Таблица 4 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b
C	O	C	N	C	2-ТОЛИЛ	OMe
C	O	C	N	C	2-ТОЛИЛ	SMe
C	O	C	N	C	2-ТОЛИЛ	Cl
C	O	C	N	C	2-ТОЛИЛ	CF ₃
C	O	C	N	C	2-ТОЛИЛ	Ph
C	O	C	N	C	3-ТОЛИЛ	H
C	O	C	N	C	3-ТОЛИЛ	Me
C	O	C	N	C	3-ТОЛИЛ	Et
C	O	C	N	C	3-ТОЛИЛ	n-Hex
C	O	C	N	C	3-ТОЛИЛ	c-Pr
C	O	C	N	C	3-ТОЛИЛ	c-Hex
C	O	C	N	C	3-ТОЛИЛ	OH
C	O	C	N	C	3-ТОЛИЛ	CH ₂ OH
C	O	C	N	C	3-ТОЛИЛ	OMe
C	O	C	N	C	3-ТОЛИЛ	SMe
C	O	C	N	C	3-ТОЛИЛ	Cl
C	O	C	N	C	3-ТОЛИЛ	CF ₃
C	O	C	N	C	3-ТОЛИЛ	Ph
C	O	C	N	C	4-ТОЛИЛ	H
C	O	C	N	C	4-ТОЛИЛ	Me
C	O	C	N	C	4-ТОЛИЛ	Et
C	O	C	N	C	4-ТОЛИЛ	n-Hex
C	O	C	N	C	4-ТОЛИЛ	c-Pr
C	O	C	N	C	4-ТОЛИЛ	c-Hex
C	O	C	N	C	4-ТОЛИЛ	OH
C	O	C	N	C	4-ТОЛИЛ	CH ₂ OH
C	O	C	N	C	4-ТОЛИЛ	OMe
C	O	C	N	C	4-ТОЛИЛ	SMe
C	O	C	N	C	4-ТОЛИЛ	Cl
C	O	C	N	C	4-ТОЛИЛ	CF ₃
C	O	C	N	C	4-ТОЛИЛ	Ph
C	O	C	N	C	Ph-2,3-Me ₂	H
C	O	C	N	C	Ph-2,3-Me ₂	Me
C	O	C	N	C	Ph-2,3-Me ₂	Et
C	O	C	N	C	Ph-2,3-Me ₂	n-Hex
C	O	C	N	C	Ph-2,3-Me ₂	c-Pr
C	O	C	N	C	Ph-2,3-Me ₂	c-Hex
C	O	C	N	C	Ph-2,3-Me ₂	OH
C	O	C	N	C	Ph-2,3-Me ₂	CH ₂ OH
C	O	C	N	C	Ph-2,3-Me ₂	OMe
C	O	C	N	C	Ph-2,3-Me ₂	SMe
C	O	C	N	C	Ph-2,3-Me ₂	Cl
C	O	C	N	C	Ph-2,3-Me ₂	CF ₃
C	O	C	N	C	Ph-2,3-Me ₂	Ph

RU 2 1 2 5 0 5 3 C 1

RU 2 1 2 5 0 5 3 C 1

RU 2125053 C1

Таблица 4 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b
C	O	C	N	C	Ph-3,4-Me ₂	H
C	O	C	N	C	Ph-3,4-Me ₂	Me
C	O	C	N	C	Ph-3,4-Me ₂	Et
C	O	C	N	C	Ph-3,4-Me ₂	n-Hex
C	O	C	N	C	Ph-3,4-Me ₂	c-Pr
C	O	C	N	C	Ph-3,4-Me ₂	c-Hex
C	O	C	N	C	Ph-3,4-Me ₂	OH
C	O	C	N	C	Ph-3,4-Me ₂	CH ₂ OH
C	O	C	N	C	Ph-3,4-Me ₂	OMe
C	O	C	N	C	Ph-3,4-Me ₂	SMe
C	O	C	N	C	Ph-3,4-Me ₂	Cl
C	O	C	N	C	Ph-3,4-Me ₂	CF ₃
C	O	C	N	C	Ph-3,4-Me ₂	Ph
C	O	C	N	C	Ph-3,5-Me ₂	H
C	O	C	N	C	Ph-3,5-Me ₂	Me
C	O	C	N	C	Ph-3,5-Me ₂	Et
C	O	C	N	C	Ph-3,5-Me ₂	n-Hex
C	O	C	N	C	Ph-3,5-Me ₂	c-Pr
C	O	C	N	C	Ph-3,5-Me ₂	c-Hex
C	O	C	N	C	Ph-3,5-Me ₂	OH
C	O	C	N	C	Ph-3,5-Me ₂	CH ₂ OH
C	O	C	N	C	Ph-3,5-Me ₂	OMe
C	O	C	N	C	Ph-3,5-Me ₂	SMe
C	O	C	N	C	Ph-3,5-Me ₂	Cl
C	O	C	N	C	Ph-3,5-Me ₂	CF ₃
C	O	C	N	C	Ph-3,5-Me ₂	Ph
C	O	C	N	C	Ph-2,6-Me ₂	H
C	O	C	N	C	Ph-2,6-Me ₂	Me
C	O	C	N	C	Ph-2,6-Me ₂	Et
C	O	C	N	C	Ph-2,6-Me ₂	n-Hex
C	O	C	N	C	Ph-2,6-Me ₂	c-Pr
C	O	C	N	C	Ph-2,6-Me ₂	c-Hex
C	O	C	N	C	Ph-2,6-Me ₂	OH
C	O	C	N	C	Ph-2,6-Me ₂	CH ₂ OH
C	O	C	N	C	Ph-2,6-Me ₂	OMe
C	O	C	N	C	Ph-2,6-Me ₂	SMe
C	O	C	N	C	Ph-2,6-Me ₂	Cl
C	O	C	N	C	Ph-2,6-Me ₂	CF ₃
C	O	C	N	C	Ph-2,6-Me ₂	Ph
C	O	C	N	C	Ph-2-Cl	H
C	O	C	N	C	Ph-2-Cl	Me
C	O	C	N	C	Ph-2-Cl	Et
C	O	C	N	C	Ph-2-Cl	n-Hex
C	O	C	N	C	Ph-2-Cl	c-Pr

RU 2125053 C1

Таблица 4 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b
C	O	C	N	C	Ph-2-Cl	c-Hex
C	O	C	N	C	Ph-2-Cl	OH
C	O	C	N	C	Ph-2-Cl	CH ₂ OH
C	O	C	N	C	Ph-2-Cl	OMe
C	O	C	N	C	Ph-2-Cl	SMe
C	O	C	N	C	Ph-2-Cl	Cl
C	O	C	N	C	Ph-2-Cl	CF ₃
C	O	C	N	C	Ph-2-Cl	Ph
C	O	C	N	C	Ph-3-Cl	H
C	O	C	N	C	Ph-3-Cl	Me
C	O	C	N	C	Ph-3-Cl	Et
C	O	C	N	C	Ph-3-Cl	n-Hex
C	O	C	N	C	Ph-3-Cl	c-Pr
C	O	C	N	C	Ph-3-Cl	c-Hex
C	O	C	N	C	Ph-3-Cl	OH
C	O	C	N	C	Ph-3-Cl	CH ₂ OH
C	O	C	N	C	Ph-3-Cl	OMe
C	O	C	N	C	Ph-3-Cl	SMe
C	O	C	N	C	Ph-3-Cl	Cl
C	O	C	N	C	Ph-3-Cl	CF ₃
C	O	C	N	C	Ph-3-Cl	Ph
C	O	C	N	C	Ph-4-Cl	H
C	O	C	N	C	Ph-4-Cl	Me
C	O	C	N	C	Ph-4-Cl	Et
C	O	C	N	C	Ph-4-Cl	n-Hex
C	O	C	N	C	Ph-4-Cl	c-Pr
C	O	C	N	C	Ph-4-Cl	c-Hex
C	O	C	N	C	Ph-4-Cl	OH
C	O	C	N	C	Ph-4-Cl	CH ₂ OH
C	O	C	N	C	Ph-4-Cl	OMe
C	O	C	N	C	Ph-4-Cl	SMe
C	O	C	N	C	Ph-4-Cl	Cl
C	O	C	N	C	Ph-4-Cl	CF ₃
C	O	C	N	C	Ph-4-Cl	Ph
C	O	C	N	C	Ph-3,4-Cl ₂	H
C	O	C	N	C	Ph-3,4-Cl ₂	Me
C	O	C	N	C	Ph-3,4-Cl ₂	Et
C	O	C	N	C	Ph-3,4-Cl ₂	n-Hex
C	O	C	N	C	Ph-3,4-Cl ₂	c-Pr
C	O	C	N	C	Ph-3,4-Cl ₂	c-Hex
C	O	C	N	C	Ph-3,4-Cl ₂	OH
C	O	C	N	C	Ph-3,4-Cl ₂	CH ₂ OH
C	O	C	N	C	Ph-3,4-Cl ₂	OMe
C	O	C	N	C	Ph-3,4-Cl ₂	SMe

RU 2125053 C1

RU 2125053 C1

Таблица 4 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b
C	O	C	N	C	Ph-3,4-Cl ₂	Cl
C	O	C	N	C	Ph-3,4-Cl ₂	CF ₃
C	O	C	N	C	Ph-3,4-Cl ₂	Ph
C	O	C	N	C	Ph-4-F	H
C	O	C	N	C	Ph-4-F	Me
C	O	C	N	C	Ph-4-F	Et
C	O	C	N	C	Ph-4-F	n-Hex
C	O	C	N	C	Ph-4-F	c-Pr
C	O	C	N	C	Ph-4-F	c-Hex
C	O	C	N	C	Ph-4-F	OH
C	O	C	N	C	Ph-4-F	CH ₂ OH
C	O	C	N	C	Ph-4-F	OMe
C	O	C	N	C	Ph-4-F	SMe
C	O	C	N	C	Ph-4-F	Cl
C	O	C	N	C	Ph-4-F	CF ₃
C	O	C	N	C	Ph-4-F	Ph
C	O	C	N	C	Ph-4-Br	H
C	O	C	N	C	Ph-4-Br	Me
C	O	C	N	C	Ph-4-Br	Et
C	O	C	N	C	Ph-4-Br	n-Hex
C	O	C	N	C	Ph-4-Br	c-Pr
C	O	C	N	C	Ph-4-Br	c-Hex
C	O	C	N	C	Ph-4-Br	OH
C	O	C	N	C	Ph-4-Br	CH ₂ OH
C	O	C	N	C	Ph-4-Br	OMe
C	O	C	N	C	Ph-4-Br	SMe
C	O	C	N	C	Ph-4-Br	Cl
C	O	C	N	C	Ph-4-Br	CF ₃
C	O	C	N	C	Ph-4-Br	Ph
C	O	C	N	C	Ph-2-OMe	H
C	O	C	N	C	Ph-2-OMe	Me
C	O	C	N	C	Ph-2-OMe	Et
C	O	C	N	C	Ph-2-OMe	n-Hex
C	O	C	N	C	Ph-2-OMe	c-Pr
C	O	C	N	C	Ph-2-OMe	c-Hex
C	O	C	N	C	Ph-2-OMe	OH
C	O	C	N	C	Ph-2-OMe	CH ₂ OH
C	O	C	N	C	Ph-2-OMe	OMe
C	O	C	N	C	Ph-2-OMe	SMe
C	O	C	N	C	Ph-2-OMe	Cl
C	O	C	N	C	Ph-2-OMe	CF ₃
C	O	C	N	C	Ph-2-OMe	Ph
C	O	C	N	C	Ph-3-OMe	H
C	O	C	N	C	Ph-3-OMe	Me

RU 2125053 C1

RU 2125053 C1

RU 2125053 C1

Таблица 4 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b
C	O	C	N	C	Ph-3-OMe	Et
C	O	C	N	C	Ph-3-OMe	n-Hex
C	O	C	N	C	Ph-3-OMe	c-Pr
C	O	C	N	C	Ph-3-OMe	c-Hex
C	O	C	N	C	Ph-3-OMe	OH
C	O	C	N	C	Ph-3-OMe	CH ₂ OH
C	O	C	N	C	Ph-3-OMe	OMe
C	O	C	N	C	Ph-3-OMe	SMe
C	O	C	N	C	Ph-3-OMe	Cl
C	O	C	N	C	Ph-3-OMe	CF ₃
C	O	C	N	C	Ph-3-OMe	Ph
C	O	C	N	C	Ph-4-OMe	H
C	O	C	N	C	Ph-4-OMe	Me
C	O	C	N	C	Ph-4-OMe	Et
C	O	C	N	C	Ph-4-OMe	n-Hex
C	O	C	N	C	Ph-4-OMe	c-Pr
C	O	C	N	C	Ph-4-OMe	c-Hex
C	O	C	N	C	Ph-4-OMe	OH
C	O	C	N	C	Ph-4-OMe	CH ₂ OH
C	O	C	N	C	Ph-4-OMe	OMe
C	O	C	N	C	Ph-4-OMe	SMe
C	O	C	N	C	Ph-4-OMe	Cl
C	O	C	N	C	Ph-4-OMe	CF ₃
C	O	C	N	C	Ph-4-OMe	Ph
C	O	C	N	C	Ph-3,4-(OMe) ₂	H
C	O	C	N	C	Ph-3,4-(OMe) ₂	Me
C	O	C	N	C	Ph-3,4-(OMe) ₂	Et
C	O	C	N	C	Ph-3,4-(OMe) ₂	n-Hex
C	O	C	N	C	Ph-3,4-(OMe) ₂	c-Pr
C	O	C	N	C	Ph-3,4-(OMe) ₂	c-Hex
C	O	C	N	C	Ph-3,4-(OMe) ₂	OH
C	O	C	N	C	Ph-3,4-(OMe) ₂	CH ₂ OH
C	O	C	N	C	Ph-3,4-(OMe) ₂	OMe
C	O	C	N	C	Ph-3,4-(OMe) ₂	SMe
C	O	C	N	C	Ph-3,4-(OMe) ₂	Cl
C	O	C	N	C	Ph-3,4-(OMe) ₂	CF ₃
C	O	C	N	C	Ph-3,4-(OMe) ₂	Ph
C	O	C	N	C	Ph-2-OH	H
C	O	C	N	C	Ph-2-OH	Me
C	O	C	N	C	Ph-2-OH	Et
C	O	C	N	C	Ph-2-OH	n-Hex
C	O	C	N	C	Ph-2-OH	c-Pr
C	O	C	N	C	Ph-2-OH	c-Hex
C	O	C	N	C	Ph-2-OH	OH

RU 2125053 C1

Таблица 4 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b
C	O	C	N	C	Ph-2-OH	CH ₂ OH
C	O	C	N	C	Ph-2-OH	OMe
C	O	C	N	C	Ph-2-OH	SMe
C	O	C	N	C	Ph-2-OH	Cl
C	O	C	N	C	Ph-2-OH	CF ₃
C	O	C	N	C	Ph-2-OH	Ph
C	O	C	N	C	Ph-3-OH	H
C	O	C	N	C	Ph-3-OH	Me
C	O	C	N	C	Ph-3-OH	Et
C	O	C	N	C	Ph-3-OH	n-Hex
C	O	C	N	C	Ph-3-OH	c-Pr
C	O	C	N	C	Ph-3-OH	c-Hex
C	O	C	N	C	Ph-3-OH	OH
C	O	C	N	C	Ph-3-OH	CH ₂ OH
C	O	C	N	C	Ph-3-OH	OMe
C	O	C	N	C	Ph-3-OH	SMe
C	O	C	N	C	Ph-3-OH	Cl
C	O	C	N	C	Ph-3-OH	CF ₃
C	O	C	N	C	Ph-3-OH	Ph
C	O	C	N	C	Ph-4-OH	H
C	O	C	N	C	Ph-4-OH	Me
C	O	C	N	C	Ph-4-OH	Et
C	O	C	N	C	Ph-4-OH	n-Hex
C	O	C	N	C	Ph-4-OH	c-Pr
C	O	C	N	C	Ph-4-OH	c-Hex
C	O	C	N	C	Ph-4-OH	OH
C	O	C	N	C	Ph-4-OH	CH ₂ OH
C	O	C	N	C	Ph-4-OH	OMe
C	O	C	N	C	Ph-4-OH	SMe
C	O	C	N	C	Ph-4-OH	Cl
C	O	C	N	C	Ph-4-OH	CF ₃
C	O	C	N	C	Ph-4-OH	Ph
C	O	C	N	C	Ph-3,4-(OH) ₂	H
C	O	C	N	C	Ph-3,4-(OH) ₂	Me
C	O	C	N	C	Ph-3,4-(OH) ₂	Et
C	O	C	N	C	Ph-3,4-(OH) ₂	n-Hex
C	O	C	N	C	Ph-3,4-(OH) ₂	c-Pr
C	O	C	N	C	Ph-3,4-(OH) ₂	c-Hex
C	O	C	N	C	Ph-3,4-(OH) ₂	OH
C	O	C	N	C	Ph-3,4-(OH) ₂	CH ₂ OH
C	O	C	N	C	Ph-3,4-(OH) ₂	OMe
C	O	C	N	C	Ph-3,4-(OH) ₂	SMe
C	O	C	N	C	Ph-3,4-(OH) ₂	Cl
C	O	C	N	C	Ph-3,4-(OH) ₂	CF ₃

Таблица 4 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b
C	O	C	N	C	Ph-3,4-(OH) ₂	Ph
C	O	C	N	C	Ph-3-SMe	H
C	O	C	N	C	Ph-3-SMe	Me
C	O	C	N	C	Ph-3-SMe	Et
C	O	C	N	C	Ph-3-SMe	n-Hex
C	O	C	N	C	Ph-3-SMe	c-Pr
C	O	C	N	C	Ph-3-SMe	c-Hex
C	O	C	N	C	Ph-3-SMe	OH
C	O	C	N	C	Ph-3-SMe	CH ₂ OH
C	O	C	N	C	Ph-3-SMe	OMe
C	O	C	N	C	Ph-3-SMe	SMe
C	O	C	N	C	Ph-3-SMe	Cl
C	O	C	N	C	Ph-3-SMe	CF ₃
C	O	C	N	C	Ph-3-SMe	Ph
C	O	C	N	C	Ph-3-CF ₃	H
C	O	C	N	C	Ph-3-CF ₃	Me
C	O	C	N	C	Ph-3-CF ₃	Et
C	O	C	N	C	Ph-3-CF ₃	n-Hex
C	O	C	N	C	Ph-3-CF ₃	c-Pr
C	O	C	N	C	Ph-3-CF ₃	c-Hex
C	O	C	N	C	Ph-3-CF ₃	OH
C	O	C	N	C	Ph-3-CF ₃	CH ₂ OH
C	O	C	N	C	Ph-3-CF ₃	OMe
C	O	C	N	C	Ph-3-CF ₃	SMe
C	O	C	N	C	Ph-3-CF ₃	Cl
C	O	C	N	C	Ph-3-CF ₃	CF ₃
C	O	C	N	C	Ph-3-CF ₃	Ph
C	O	C	N	C	Ph-3-NO ₂	H
C	O	C	N	C	Ph-3-NO ₂	Me
C	O	C	N	C	Ph-3-NO ₂	Et
C	O	C	N	C	Ph-3-NO ₂	n-Hex
C	O	C	N	C	Ph-3-NO ₂	c-Pr
C	O	C	N	C	Ph-3-NO ₂	c-Hex
C	O	C	N	C	Ph-3-NO ₂	OH
C	O	C	N	C	Ph-3-NO ₂	CH ₂ OH
C	O	C	N	C	Ph-3-NO ₂	OMe
C	O	C	N	C	Ph-3-NO ₂	SMe
C	O	C	N	C	Ph-3-NO ₂	Cl
C	O	C	N	C	Ph-3-NO ₂	CF ₃
C	O	C	N	C	Ph-3-NO ₂	Ph
C	O	C	N	C	Ph-4-NMe ₂	H
C	O	C	N	C	Ph-4-NMe ₂	Me
C	O	C	N	C	Ph-4-NMe ₂	Et
C	O	C	N	C	Ph-4-NMe ₂	n-Hex

RU 2125053 C1

RU 2125053 C1

Таблица 4 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b
C	O	C	N	C	Ph-4-NMe ₂	c-Pr
C	O	C	N	C	Ph-4-NMe ₂	c-Hex
C	O	C	N	C	Ph-4-NMe ₂	OH
C	O	C	N	C	Ph-4-NMe ₂	CH ₂ OH
C	O	C	N	C	Ph-4-NMe ₂	OMe
C	O	C	N	C	Ph-4-NMe ₂	SMe
C	O	C	N	C	Ph-4-NMe ₂	Cl
C	O	C	N	C	Ph-4-NMe ₂	CF ₃
C	O	C	N	C	Ph-4-NMe ₂	Ph
C	S	C	N	C	Ph	H
C	S	C	N	C	Ph	Me
C	S	C	N	C	Ph	Et
C	S	C	N	C	Ph	n-Hex
C	S	C	N	C	Ph	c-Pr
C	S	C	N	C	Ph	c-Hex
C	S	C	N	C	Ph	OH
C	S	C	N	C	Ph	CH ₂ OH
C	S	C	N	C	Ph	OMe
C	S	C	N	C	Ph	SMe
C	S	C	N	C	Ph	Cl
C	S	C	N	C	Ph	CF ₃
C	S	C	N	C	Ph	Ph
C	S	C	N	C	H	H
C	S	C	N	C	H	Me
C	S	C	N	C	H	Et
C	S	C	N	C	H	n-Hex
C	S	C	N	C	H	c-Pr
C	S	C	N	C	H	c-Hex
C	S	C	N	C	H	OH
C	S	C	N	C	H	CH ₂ OH
C	S	C	N	C	H	OMe
C	S	C	N	C	H	SMe
C	S	C	N	C	H	Cl
C	S	C	N	C	H	CF ₃
C	S	C	N	C	H	Ph
C	S	C	N	C	Me	H
C	S	C	N	C	Me	Me
C	S	C	N	C	Me	Et
C	S	C	N	C	Me	n-Hex
C	S	C	N	C	Me	c-Pr
C	S	C	N	C	Me	c-Hex
C	S	C	N	C	Me	OH
C	S	C	N	C	Me	CH ₂ OH
C	S	C	N	C	Me	OMe

RU 2125053 C1

RU 2125053 C1

Таблица 4 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b
C	S	C	N	C	Me	SMe
C	S	C	N	C	Me	Cl
C	S	C	N	C	Me	CF ₃
C	S	C	N	C	Me	Ph
C	S	C	N	C	Et	H
C	S	C	N	C	Et	Me
C	S	C	N	C	Et	Et
C	S	C	N	C	Et	n-Hex
C	S	C	N	C	Et	c-Pr
C	S	C	N	C	Et	c-Hex
C	S	C	N	C	Et	OH
C	S	C	N	C	Et	CH ₂ OH
C	S	C	N	C	Et	OMe
C	S	C	N	C	Et	SMe
C	S	C	N	C	Et	Cl
C	S	C	N	C	Et	CF ₃
C	S	C	N	C	Et	Ph
C	S	C	N	C	n-Pr	H
C	S	C	N	C	n-Pr	Me
C	S	C	N	C	n-Pr	Et
C	S	C	N	C	n-Pr	n-Hex
C	S	C	N	C	n-Pr	c-Pr
C	S	C	N	C	n-Pr	c-Hex
C	S	C	N	C	n-Pr	OH
C	S	C	N	C	n-Pr	CH ₂ OH
C	S	C	N	C	n-Pr	OMe
C	S	C	N	C	n-Pr	SMe
C	S	C	N	C	n-Pr	Cl
C	S	C	N	C	n-Pr	CF ₃
C	S	C	N	C	n-Pr	Ph
C	S	C	N	C	n-Hex	H
C	S	C	N	C	n-Hex	Me
C	S	C	N	C	n-Hex	Et
C	S	C	N	C	n-Hex	n-Hex
C	S	C	N	C	n-Hex	c-Pr
C	S	C	N	C	n-Hex	c-Hex
C	S	C	N	C	n-Hex	OH
C	S	C	N	C	n-Hex	CH ₂ OH
C	S	C	N	C	n-Hex	OMe
C	S	C	N	C	n-Hex	SMe
C	S	C	N	C	n-Hex	Cl
C	S	C	N	C	n-Hex	CF ₃
C	S	C	N	C	n-Hex	Ph
C	S	C	N	C	i-Pr	H

RU 2125053 C1

RU 2125053 C1

Таблица 4 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b
C	S	C	N	C	i-Pr	Me
C	S	C	N	C	i-Pr	Et
C	S	C	N	C	i-Pr	n-Hex
C	S	C	N	C	i-Pr	c-Pr
C	S	C	N	C	i-Pr	c-Hex
C	S	C	N	C	i-Pr	OH
C	S	C	N	C	i-Pr	CH ₂ OH
C	S	C	N	C	i-Pr	OMe
C	S	C	N	C	i-Pr	SMe
C	S	C	N	C	i-Pr	Cl
C	S	C	N	C	i-Pr	CF ₃
C	S	C	N	C	i-Pr	Ph
C	S	C	N	C	t-Bu	H
C	S	C	N	C	t-Bu	Me
C	S	C	N	C	t-Bu	Et
C	S	C	N	C	t-Bu	n-Hex
C	S	C	N	C	t-Bu	c-Pr
C	S	C	N	C	t-Bu	c-Hex
C	S	C	N	C	t-Bu	OH
C	S	C	N	C	t-Bu	CH ₂ OH
C	S	C	N	C	t-Bu	OMe
C	S	C	N	C	t-Bu	SMe
C	S	C	N	C	t-Bu	Cl
C	S	C	N	C	t-Bu	CF ₃
C	S	C	N	C	t-Bu	Ph
C	S	C	N	C	c-Hex	H
C	S	C	N	C	c-Hex	Me
C	S	C	N	C	c-Hex	Et
C	S	C	N	C	c-Hex	n-Hex
C	S	C	N	C	c-Hex	c-Pr
C	S	C	N	C	c-Hex	c-Hex
C	S	C	N	C	c-Hex	OH
C	S	C	N	C	c-Hex	CH ₂ OH
C	S	C	N	C	c-Hex	OMe
C	S	C	N	C	c-Hex	SMe
C	S	C	N	C	c-Hex	Cl
C	S	C	N	C	c-Hex	CF ₃
C	S	C	N	C	c-Hex	Ph
C	S	C	N	C	3-ц-гексенил	H
C	S	C	N	C	3-ц-гексенил	Me
C	S	C	N	C	3-ц-гексенил	Et
C	S	C	N	C	3-ц-гексенил	n-Hex
C	S	C	N	C	3-ц-гексенил	c-Pr
C	S	C	N	C	3-ц-гексенил	c-Hex

RU 2125053 C1

RU 2125053 C1

Таблица 4 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b
C	S	C	N	C	3-ц-гексенил	OH
C	S	C	N	C	3-ц-гексенил	CH ₂ OH
C	S	C	N	C	3-ц-гексенил	OMe
C	S	C	N	C	3-ц-гексенил	SMe
C	S	C	N	C	3-ц-гексенил	Cl
C	S	C	N	C	3-ц-гексенил	CF ₃
C	S	C	N	C	3-ц-гексенил	Ph
C	S	C	N	C	CH ₂ OH	H
C	S	C	N	C	CH ₂ OH	Me
C	S	C	N	C	CH ₂ OH	Et
C	S	C	N	C	CH ₂ OH	n-Hex
C	S	C	N	C	CH ₂ OH	c-Pr
C	S	C	N	C	CH ₂ OH	c-Hex
C	S	C	N	C	CH ₂ OH	OH
C	S	C	N	C	CH ₂ OH	CH ₂ OH
C	S	C	N	C	CH ₂ OH	OMe
C	S	C	N	C	CH ₂ OH	SMe
C	S	C	N	C	CH ₂ OH	Cl
C	S	C	N	C	CH ₂ OH	CF ₃
C	S	C	N	C	CH ₂ OH	Ph
C	S	C	N	C	CH ₂ Ph	H
C	S	C	N	C	CH ₂ Ph	Me
C	S	C	N	C	CH ₂ Ph	Et
C	S	C	N	C	CH ₂ Ph	n-Hex
C	S	C	N	C	CH ₂ Ph	c-Pr
C	S	C	N	C	CH ₂ Ph	c-Hex
C	S	C	N	C	CH ₂ Ph	OH
C	S	C	N	C	CH ₂ Ph	CH ₂ OH
C	S	C	N	C	CH ₂ Ph	OMe
C	S	C	N	C	CH ₂ Ph	SMe
C	S	C	N	C	CH ₂ Ph	Cl
C	S	C	N	C	CH ₂ Ph	CF ₃
C	S	C	N	C	CH ₂ Ph	Ph
C	S	C	N	C	α-нафтил	H
C	S	C	N	C	α-нафтил	Me
C	S	C	N	C	α-нафтил	Et
C	S	C	N	C	α-нафтил	n-Hex
C	S	C	N	C	α-нафтил	c-Pr
C	S	C	N	C	α-нафтил	c-Hex
C	S	C	N	C	α-нафтил	OH
C	S	C	N	C	α-нафтил	CH ₂ OH
C	S	C	N	C	α-нафтил	OMe
C	S	C	N	C	α-нафтил	SMe
C	S	C	N	C	α-нафтил	Cl

RU 2125053 C1

RU 2125053 C1

Таблица 4 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b
C	S	C	N	C	α -нафтил	CF ₃
C	S	C	N	C	α -нафтил	Ph
C	S	C	N	C	β -нафтил	H
C	S	C	N	C	β -нафтил	Me
C	S	C	N	C	β -нафтил	Et
C	S	C	N	C	β -нафтил	n-Hex
C	S	C	N	C	β -нафтил	c-Pr
C	S	C	N	C	β -нафтил	c-Hex
C	S	C	N	C	β -нафтил	OH
C	S	C	N	C	β -нафтил	CH ₂ OH
C	S	C	N	C	β -нафтил	OMe
C	S	C	N	C	β -нафтил	SMe
C	S	C	N	C	β -нафтил	Cl
C	S	C	N	C	β -нафтил	CF ₃
C	S	C	N	C	β -нафтил	Ph
C	S	C	N	C	2-пиридил	H
C	S	C	N	C	2-пиридил	Me
C	S	C	N	C	2-пиридил	Et
C	S	C	N	C	2-пиридил	n-Hex
C	S	C	N	C	2-пиридил	c-Pr
C	S	C	N	C	2-пиридил	c-Hex
C	S	C	N	C	2-пиридил	OH
C	S	C	N	C	2-пиридил	CH ₂ OH
C	S	C	N	C	2-пиридил	OMe
C	S	C	N	C	2-пиридил	SMe
C	S	C	N	C	2-пиридил	Cl
C	S	C	N	C	2-пиридил	CF ₃
C	S	C	N	C	2-пиридил	Ph
C	S	C	N	C	3-пиридил	H
C	S	C	N	C	3-пиридил	Me
C	S	C	N	C	3-пиридил	Et
C	S	C	N	C	3-пиридил	n-Hex
C	S	C	N	C	3-пиридил	c-Pr
C	S	C	N	C	3-пиридил	c-Hex
C	S	C	N	C	3-пиридил	OH
C	S	C	N	C	3-пиридил	CH ₂ OH
C	S	C	N	C	3-пиридил	OMe
C	S	C	N	C	3-пиридил	SMe
C	S	C	N	C	3-пиридил	Cl
C	S	C	N	C	3-пиридил	CF ₃
C	S	C	N	C	3-пиридил	Ph
C	S	C	N	C	4-пиридил	H
C	S	C	N	C	4-пиридил	Me
C	S	C	N	C	4-пиридил	Et

RU 2 1 2 5 0 5 3 C 1

RU 2 1 2 5 0 5 3 C 1

Таблица 4 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b
C	S	C	N	C	4-пиридил	n-Hex
C	S	C	N	C	4-пиридил	c-Pr
C	S	C	N	C	4-пиридил	c-Hex
C	S	C	N	C	4-пиридил	OH
C	S	C	N	C	4-пиридил	CH ₂ OH
C	S	C	N	C	4-пиридил	OMe
C	S	C	N	C	4-пиридил	SMe
C	S	C	N	C	4-пиридил	Cl
C	S	C	N	C	4-пиридил	CF ₃
C	S	C	N	C	4-пиридил	Ph
C	S	C	N	C	2-фуранил	H
C	S	C	N	C	2-фуранил	Me
C	S	C	N	C	2-фуранил	Et
C	S	C	N	C	2-фуранил	n-Hex
C	S	C	N	C	2-фуранил	c-Pr
C	S	C	N	C	2-фуранил	c-Hex
C	S	C	N	C	2-фуранил	OH
C	S	C	N	C	2-фуранил	CH ₂ OH
C	S	C	N	C	2-фуранил	OMe
C	S	C	N	C	2-фуранил	SMe
C	S	C	N	C	2-фуранил	Cl
C	S	C	N	C	2-фуранил	CF ₃
C	S	C	N	C	2-фуранил	Ph
C	S	C	N	C	2-тиенил	H
C	S	C	N	C	2-тиенил	Me
C	S	C	N	C	2-тиенил	Et
C	S	C	N	C	2-тиенил	n-Hex
C	S	C	N	C	2-тиенил	c-Pr
C	S	C	N	C	2-тиенил	c-Hex
C	S	C	N	C	2-тиенил	OH
C	S	C	N	C	2-тиенил	CH ₂ OH
C	S	C	N	C	2-тиенил	OMe
C	S	C	N	C	2-тиенил	SMe
C	S	C	N	C	2-тиенил	Cl
C	S	C	N	C	2-тиенил	CF ₃
C	S	C	N	C	2-тиенил	Ph
C	S	C	N	C	2-толил	H
C	S	C	N	C	2-толил	Me
C	S	C	N	C	2-толил	Et
C	S	C	N	C	2-толил	n-Hex
C	S	C	N	C	2-толил	c-Pr
C	S	C	N	C	2-толил	c-Hex
C	S	C	N	C	2-толил	OH
C	S	C	N	C	2-толил	CH ₂ OH

RU 2125053 C1

RU 2125053 C1

Таблица 4 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b
C	S	C	N	C	2-ТОЛИЛ	OMe
C	S	C	N	C	2-ТОЛИЛ	SMe
C	S	C	N	C	2-ТОЛИЛ	Cl
C	S	C	N	C	2-ТОЛИЛ	CF ₃
C	S	C	N	C	2-ТОЛИЛ	Ph
C	S	C	N	C	3-ТОЛИЛ	H
C	S	C	N	C	3-ТОЛИЛ	Me
C	S	C	N	C	3-ТОЛИЛ	Et
C	S	C	N	C	3-ТОЛИЛ	n-Hex
C	S	C	N	C	3-ТОЛИЛ	c-Pr
C	S	C	N	C	3-ТОЛИЛ	c-Hex
C	S	C	N	C	3-ТОЛИЛ	OH
C	S	C	N	C	3-ТОЛИЛ	CH ₂ OH
C	S	C	N	C	3-ТОЛИЛ	OMe
C	S	C	N	C	3-ТОЛИЛ	SMe
C	S	C	N	C	3-ТОЛИЛ	Cl
C	S	C	N	C	3-ТОЛИЛ	CF ₃
C	S	C	N	C	3-ТОЛИЛ	Ph
C	S	C	N	C	4-ТОЛИЛ	H
C	S	C	N	C	4-ТОЛИЛ	Me
C	S	C	N	C	4-ТОЛИЛ	Et
C	S	C	N	C	4-ТОЛИЛ	n-Hex
C	S	C	N	C	4-ТОЛИЛ	c-Pr
C	S	C	N	C	4-ТОЛИЛ	c-Hex
C	S	C	N	C	4-ТОЛИЛ	OH
C	S	C	N	C	4-ТОЛИЛ	CH ₂ OH
C	S	C	N	C	4-ТОЛИЛ	OMe
C	S	C	N	C	4-ТОЛИЛ	SMe
C	S	C	N	C	4-ТОЛИЛ	Cl
C	S	C	N	C	4-ТОЛИЛ	CF ₃
C	S	C	N	C	4-ТОЛИЛ	Ph
C	S	C	N	C	Ph-2,3-Me ₂	H
C	S	C	N	C	Ph-2,3-Me ₂	Me
C	S	C	N	C	Ph-2,3-Me ₂	Et
C	S	C	N	C	Ph-2,3-Me ₂	n-Hex
C	S	C	N	C	Ph-2,3-Me ₂	c-Pr
C	S	C	N	C	Ph-2,3-Me ₂	c-Hex
C	S	C	N	C	Ph-2,3-Me ₂	OH
C	S	C	N	C	Ph-2,3-Me ₂	CH ₂ OH
C	S	C	N	C	Ph-2,3-Me ₂	OMe
C	S	C	N	C	Ph-2,3-Me ₂	SMe
C	S	C	N	C	Ph-2,3-Me ₂	Cl
C	S	C	N	C	Ph-2,3-Me ₂	CF ₃
C	S	C	N	C	Ph-2,3-Me ₂	Ph

RU 2 1 2 5 0 5 3 C 1

RU 2 1 2 5 0 5 3 C 1

RU 2125053 C1

Таблица 4 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b
C	S	C	N	C	Ph-3,4-Me ₂	H
C	S	C	N	C	Ph-3,4-Me ₂	Me
C	S	C	N	C	Ph-3,4-Me ₂	Et
C	S	C	N	C	Ph-3,4-Me ₂	n-Hex
C	S	C	N	C	Ph-3,4-Me ₂	c-Pr
C	S	C	N	C	Ph-3,4-Me ₂	c-Hex
C	S	C	N	C	Ph-3,4-Me ₂	OH
C	S	C	N	C	Ph-3,4-Me ₂	CH ₂ OH
C	S	C	N	C	Ph-3,4-Me ₂	OMe
C	S	C	N	C	Ph-3,4-Me ₂	SMe
C	S	C	N	C	Ph-3,4-Me ₂	Cl
C	S	C	N	C	Ph-3,4-Me ₂	CF ₃
C	S	C	N	C	Ph-3,4-Me ₂	Ph
C	S	C	N	C	Ph-3,5-Me ₂	H
C	S	C	N	C	Ph-3,5-Me ₂	Me
C	S	C	N	C	Ph-3,5-Me ₂	Et
C	S	C	N	C	Ph-3,5-Me ₂	n-Hex
C	S	C	N	C	Ph-3,5-Me ₂	c-Pr
C	S	C	N	C	Ph-3,5-Me ₂	c-Hex
C	S	C	N	C	Ph-3,5-Me ₂	OH
C	S	C	N	C	Ph-3,5-Me ₂	CH ₂ OH
C	S	C	N	C	Ph-3,5-Me ₂	OMe
C	S	C	N	C	Ph-3,5-Me ₂	SMe
C	S	C	N	C	Ph-3,5-Me ₂	Cl
C	S	C	N	C	Ph-3,5-Me ₂	CF ₃
C	S	C	N	C	Ph-3,5-Me ₂	Ph
C	S	C	N	C	Ph-2,6-Me ₂	H
C	S	C	N	C	Ph-2,6-Me ₂	Me
C	S	C	N	C	Ph-2,6-Me ₂	Et
C	S	C	N	C	Ph-2,6-Me ₂	n-Hex
C	S	C	N	C	Ph-2,6-Me ₂	c-Pr
C	S	C	N	C	Ph-2,6-Me ₂	c-Hex
C	S	C	N	C	Ph-2,6-Me ₂	OH
C	S	C	N	C	Ph-2,6-Me ₂	CH ₂ OH
C	S	C	N	C	Ph-2,6-Me ₂	OMe
C	S	C	N	C	Ph-2,6-Me ₂	SMe
C	S	C	N	C	Ph-2,6-Me ₂	Cl
C	S	C	N	C	Ph-2,6-Me ₂	CF ₃
C	S	C	N	C	Ph-2,6-Me ₂	Ph
C	S	C	N	C	Ph-2-Cl	H
C	S	C	N	C	Ph-2-Cl	Me
C	S	C	N	C	Ph-2-Cl	Et
C	S	C	N	C	Ph-2-Cl	n-Hex
C	S	C	N	C	Ph-2-Cl	c-Pr

RU 2125053 C1

Таблица 4 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b
C	S	C	N	C	Ph-2-Cl	c-Hex
C	S	C	N	C	Ph-2-Cl	OH
C	S	C	N	C	Ph-2-Cl	CH ₂ OH
C	S	C	N	C	Ph-2-Cl	OMe
C	S	C	N	C	Ph-2-Cl	SMe
C	S	C	N	C	Ph-2-Cl	Cl
C	S	C	N	C	Ph-2-Cl	CF ₃
C	S	C	N	C	Ph-2-Cl	Ph
C	S	C	N	C	Ph-3-Cl	H
C	S	C	N	C	Ph-3-Cl	Me
C	S	C	N	C	Ph-3-Cl	Et
C	S	C	N	C	Ph-3-Cl	n-Hex
C	S	C	N	C	Ph-3-Cl	c-Pr
C	S	C	N	C	Ph-3-Cl	c-Hex
C	S	C	N	C	Ph-3-Cl	OH
C	S	C	N	C	Ph-3-Cl	CH ₂ OH
C	S	C	N	C	Ph-3-Cl	OMe
C	S	C	N	C	Ph-3-Cl	SMe
C	S	C	N	C	Ph-3-Cl	Cl
C	S	C	N	C	Ph-3-Cl	CF ₃
C	S	C	N	C	Ph-3-Cl	Ph
C	S	C	N	C	Ph-4-Cl	H
C	S	C	N	C	Ph-4-Cl	Me
C	S	C	N	C	Ph-4-Cl	Et
C	S	C	N	C	Ph-4-Cl	n-Hex
C	S	C	N	C	Ph-4-Cl	c-Pr
C	S	C	N	C	Ph-4-Cl	c-Hex
C	S	C	N	C	Ph-4-Cl	OH
C	S	C	N	C	Ph-4-Cl	CH ₂ OH
C	S	C	N	C	Ph-4-Cl	OMe
C	S	C	N	C	Ph-4-Cl	SMe
C	S	C	N	C	Ph-4-Cl	Cl
C	S	C	N	C	Ph-4-Cl	CF ₃
C	S	C	N	C	Ph-4-Cl	Ph
C	S	C	N	C	Ph-3,4-Cl ₂	H
C	S	C	N	C	Ph-3,4-Cl ₂	Me
C	S	C	N	C	Ph-3,4-Cl ₂	Et
C	S	C	N	C	Ph-3,4-Cl ₂	n-Hex
C	S	C	N	C	Ph-3,4-Cl ₂	c-Pr
C	S	C	N	C	Ph-3,4-Cl ₂	c-Hex
C	S	C	N	C	Ph-3,4-Cl ₂	OH
C	S	C	N	C	Ph-3,4-Cl ₂	CH ₂ OH
C	S	C	N	C	Ph-3,4-Cl ₂	OMe
C	S	C	N	C	Ph-3,4-Cl ₂	SMe

RU 2125053 C1

RU 2125053 C1

Таблица 4 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b
C	S	C	N	C	Ph-3,4-Cl ₂	Cl
C	S	C	N	C	Ph-3,4-Cl ₂	CF ₃
C	S	C	N	C	Ph-3,4-Cl ₂	Ph
C	S	C	N	C	Ph-4-F	H
C	S	C	N	C	Ph-4-F	Me
C	S	C	N	C	Ph-4-F	Et
C	S	C	N	C	Ph-4-F	n-Hex
C	S	C	N	C	Ph-4-F	c-Pr
C	S	C	N	C	Ph-4-F	c-Hex
C	S	C	N	C	Ph-4-F	OH
C	S	C	N	C	Ph-4-F	CH ₂ OH
C	S	C	N	C	Ph-4-F	OMe
C	S	C	N	C	Ph-4-F	SMe
C	S	C	N	C	Ph-4-F	Cl
C	S	C	N	C	Ph-4-F	CF ₃
C	S	C	N	C	Ph-4-F	Ph
C	S	C	N	C	Ph-4-Br	H
C	S	C	N	C	Ph-4-Br	Me
C	S	C	N	C	Ph-4-Br	Et
C	S	C	N	C	Ph-4-Br	n-Hex
C	S	C	N	C	Ph-4-Br	c-Pr
C	S	C	N	C	Ph-4-Br	c-Hex
C	S	C	N	C	Ph-4-Br	OH
C	S	C	N	C	Ph-4-Br	CH ₂ OH
C	S	C	N	C	Ph-4-Br	OMe
C	S	C	N	C	Ph-4-Br	SMe
C	S	C	N	C	Ph-4-Br	Cl
C	S	C	N	C	Ph-4-Br	CF ₃
C	S	C	N	C	Ph-4-Br	Ph
C	S	C	N	C	Ph-2-OMe	H
C	S	C	N	C	Ph-2-OMe	Me
C	S	C	N	C	Ph-2-OMe	Et
C	S	C	N	C	Ph-2-OMe	n-Hex
C	S	C	N	C	Ph-2-OMe	c-Pr
C	S	C	N	C	Ph-2-OMe	c-Hex
C	S	C	N	C	Ph-2-OMe	OH
C	S	C	N	C	Ph-2-OMe	CH ₂ OH
C	S	C	N	C	Ph-2-OMe	OMe
C	S	C	N	C	Ph-2-OMe	SMe
C	S	C	N	C	Ph-2-OMe	Cl
C	S	C	N	C	Ph-2-OMe	CF ₃
C	S	C	N	C	Ph-2-OMe	Ph
C	S	C	N	C	Ph-3-OMe	H
C	S	C	N	C	Ph-3-OMe	Me

RU 2125053 C1

RU 2125053 C1

Таблица 4 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b
C	S	C	N	C	Ph-3-OMe	Et
C	S	C	N	C	Ph-3-OMe	n-Hex
C	S	C	N	C	Ph-3-OMe	c-Pr
C	S	C	N	C	Ph-3-OMe	c-Hex
C	S	C	N	C	Ph-3-OMe	OH
C	S	C	N	C	Ph-3-OMe	CH ₂ OH
C	S	C	N	C	Ph-3-OMe	OMe
C	S	C	N	C	Ph-3-OMe	SMe
C	S	C	N	C	Ph-3-OMe	Cl
C	S	C	N	C	Ph-3-OMe	CF ₃
C	S	C	N	C	Ph-3-OMe	Ph
C	S	C	N	C	Ph-4-OMe	H
C	S	C	N	C	Ph-4-OMe	Me
C	S	C	N	C	Ph-4-OMe	Et
C	S	C	N	C	Ph-4-OMe	n-Hex
C	S	C	N	C	Ph-4-OMe	c-Pr
C	S	C	N	C	Ph-4-OMe	c-Hex
C	S	C	N	C	Ph-4-OMe	OH
C	S	C	N	C	Ph-4-OMe	CH ₂ OH
C	S	C	N	C	Ph-4-OMe	OMe
C	S	C	N	C	Ph-4-OMe	SMe
C	S	C	N	C	Ph-4-OMe	Cl
C	S	C	N	C	Ph-4-OMe	CF ₃
C	S	C	N	C	Ph-4-OMe	Ph
C	S	C	N	C	Ph-3,4-(OMe) ₂	H
C	S	C	N	C	Ph-3,4-(OMe) ₂	Me
C	S	C	N	C	Ph-3,4-(OMe) ₂	Et
C	S	C	N	C	Ph-3,4-(OMe) ₂	n-Hex
C	S	C	N	C	Ph-3,4-(OMe) ₂	c-Pr
C	S	C	N	C	Ph-3,4-(OMe) ₂	c-Hex
C	S	C	N	C	Ph-3,4-(OMe) ₂	OH
C	S	C	N	C	Ph-3,4-(OMe) ₂	CH ₂ OH
C	S	C	N	C	Ph-3,4-(OMe) ₂	OMe
C	S	C	N	C	Ph-3,4-(OMe) ₂	SMe
C	S	C	N	C	Ph-3,4-(OMe) ₂	Cl
C	S	C	N	C	Ph-3,4-(OMe) ₂	CF ₃
C	S	C	N	C	Ph-3,4-(OMe) ₂	Ph
C	S	C	N	C	Ph-2-OH	H
C	S	C	N	C	Ph-2-OH	Me
C	S	C	N	C	Ph-2-OH	Et
C	S	C	N	C	Ph-2-OH	n-Hex
C	S	C	N	C	Ph-2-OH	c-Pr
C	S	C	N	C	Ph-2-OH	c-Hex
C	S	C	N	C	Ph-2-OH	OH

RU 2125053 C1

RU 2125053 C1

Таблица 4 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b
C	S	C	N	C	Ph-2-OH	CH ₂ OH
C	S	C	N	C	Ph-2-OH	OMe
C	S	C	N	C	Ph-2-OH	SMe
C	S	C	N	C	Ph-2-OH	Cl
C	S	C	N	C	Ph-2-OH	CF ₃
C	S	C	N	C	Ph-2-OH	Ph
C	S	C	N	C	Ph-3-OH	H
C	S	C	N	C	Ph-3-OH	Me
C	S	C	N	C	Ph-3-OH	Et
C	S	C	N	C	Ph-3-OH	n-Hex
C	S	C	N	C	Ph-3-OH	c-Pr
C	S	C	N	C	Ph-3-OH	c-Hex
C	S	C	N	C	Ph-3-OH	OH
C	S	C	N	C	Ph-3-OH	CH ₂ OH
C	S	C	N	C	Ph-3-OH	OMe
C	S	C	N	C	Ph-3-OH	SMe
C	S	C	N	C	Ph-3-OH	Cl
C	S	C	N	C	Ph-3-OH	CF ₃
C	S	C	N	C	Ph-3-OH	Ph
C	S	C	N	C	Ph-4-OH	H
C	S	C	N	C	Ph-4-OH	Me
C	S	C	N	C	Ph-4-OH	Et
C	S	C	N	C	Ph-4-OH	n-Hex
C	S	C	N	C	Ph-4-OH	c-Pr
C	S	C	N	C	Ph-4-OH	c-Hex
C	S	C	N	C	Ph-4-OH	OH
C	S	C	N	C	Ph-4-OH	CH ₂ OH
C	S	C	N	C	Ph-4-OH	OMe
C	S	C	N	C	Ph-4-OH	SMe
C	S	C	N	C	Ph-4-OH	Cl
C	S	C	N	C	Ph-4-OH	CF ₃
C	S	C	N	C	Ph-4-OH	Ph
C	S	C	N	C	Ph-3,4-(OH) ₂	H
C	S	C	N	C	Ph-3,4-(OH) ₂	Me
C	S	C	N	C	Ph-3,4-(OH) ₂	Et
C	S	C	N	C	Ph-3,4-(OH) ₂	n-Hex
C	S	C	N	C	Ph-3,4-(OH) ₂	c-Pr
C	S	C	N	C	Ph-3,4-(OH) ₂	c-Hex
C	S	C	N	C	Ph-3,4-(OH) ₂	OH
C	S	C	N	C	Ph-3,4-(OH) ₂	CH ₂ OH
C	S	C	N	C	Ph-3,4-(OH) ₂	OMe
C	S	C	N	C	Ph-3,4-(OH) ₂	SMe
C	S	C	N	C	Ph-3,4-(OH) ₂	Cl
C	S	C	N	C	Ph-3,4-(OH) ₂	CF ₃

RU 2125053 C1

RU 2125053 C1

Таблица 4 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b
C	S	C	N	C	Ph-3,4-(OH) ₂	Ph
C	S	C	N	C	Ph-3-SMe	H
C	S	C	N	C	Ph-3-SMe	Me
C	S	C	N	C	Ph-3-SMe	Et
C	S	C	N	C	Ph-3-SMe	n-Hex
C	S	C	N	C	Ph-3-SMe	c-Pr
C	S	C	N	C	Ph-3-SMe	c-Hex
C	S	C	N	C	Ph-3-SMe	OH
C	S	C	N	C	Ph-3-SMe	CH ₂ OH
C	S	C	N	C	Ph-3-SMe	OMe
C	S	C	N	C	Ph-3-SMe	SMe
C	S	C	N	C	Ph-3-SMe	Cl
C	S	C	N	C	Ph-3-SMe	CF ₃
C	S	C	N	C	Ph-3-SMe	Ph
C	S	C	N	C	Ph-3-CF ₃	H
C	S	C	N	C	Ph-3-CF ₃	Me
C	S	C	N	C	Ph-3-CF ₃	Et
C	S	C	N	C	Ph-3-CF ₃	n-Hex
C	S	C	N	C	Ph-3-CF ₃	c-Pr
C	S	C	N	C	Ph-3-CF ₃	c-Hex
C	S	C	N	C	Ph-3-CF ₃	OH
C	S	C	N	C	Ph-3-CF ₃	CH ₂ OH
C	S	C	N	C	Ph-3-CF ₃	OMe
C	S	C	N	C	Ph-3-CF ₃	SMe
C	S	C	N	C	Ph-3-CF ₃	Cl
C	S	C	N	C	Ph-3-CF ₃	CF ₃
C	S	C	N	C	Ph-3-CF ₃	Ph
C	S	C	N	C	Ph-3-NO ₂	H
C	S	C	N	C	Ph-3-NO ₂	Me
C	S	C	N	C	Ph-3-NO ₂	Et
C	S	C	N	C	Ph-3-NO ₂	n-Hex
C	S	C	N	C	Ph-3-NO ₂	c-Pr
C	S	C	N	C	Ph-3-NO ₂	c-Hex
C	S	C	N	C	Ph-3-NO ₂	OH
C	S	C	N	C	Ph-3-NO ₂	CH ₂ OH
C	S	C	N	C	Ph-3-NO ₂	OMe
C	S	C	N	C	Ph-3-NO ₂	SMe
C	S	C	N	C	Ph-3-NO ₂	Cl
C	S	C	N	C	Ph-3-NO ₂	CF ₃
C	S	C	N	C	Ph-3-NO ₂	Ph
C	S	C	N	C	Ph-4-NMe ₂	H
C	S	C	N	C	Ph-4-NMe ₂	Me
C	S	C	N	C	Ph-4-NMe ₂	Et
C	S	C	N	C	Ph-4-NMe ₂	n-Hex

RU 2125053 C1

RU 2125053 C1

Таблица 4 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b
C	S	C	N	C	Ph-4-NMe ₂	c-Pr
C	S	C	N	C	Ph-4-NMe ₂	c-Hex
C	S	C	N	C	Ph-4-NMe ₂	OH
C	S	C	N	C	Ph-4-NMe ₂	CH ₂ OH
C	S	C	N	C	Ph-4-NMe ₂	OMe
C	S	C	N	C	Ph-4-NMe ₂	SMe
C	S	C	N	C	Ph-4-NMe ₂	Cl
C	S	C	N	C	Ph-4-NMe ₂	CF ₃
C	S	C	N	C	Ph-4-NMe ₂	Ph
C	N	N	N	C	Ph	H
C	N	N	N	C	Ph	Me
C	N	N	N	C	Ph	Et
C	N	N	N	C	Ph	n-Hex
C	N	N	N	C	Ph	c-Pr
C	N	N	N	C	Ph	c-Hex
C	N	N	N	C	Ph	OH
C	N	N	N	C	Ph	CH ₂ OH
C	N	N	N	C	Ph	OMe
C	N	N	N	C	Ph	SMe
C	N	N	N	C	Ph	Cl
C	N	N	N	C	Ph	CF ₃
C	N	N	N	C	Ph	Ph
C	N	N	N	C	H	H
C	N	N	N	C	H	Me
C	N	N	N	C	H	Et
C	N	N	N	C	H	n-Hex
C	N	N	N	C	H	c-Pr
C	N	N	N	C	H	c-Hex
C	N	N	N	C	H	OH
C	N	N	N	C	H	CH ₂ OH
C	N	N	N	C	H	OMe
C	N	N	N	C	H	SMe
C	N	N	N	C	H	Cl
C	N	N	N	C	H	CF ₃
C	N	N	N	C	H	Ph
C	N	N	N	C	Me	H
C	N	N	N	C	Me	Me
C	N	N	N	C	Me	Et
C	N	N	N	C	Me	n-Hex
C	N	N	N	C	Me	c-Pr
C	N	N	N	C	Me	c-Hex
C	N	N	N	C	Me	OH
C	N	N	N	C	Me	CH ₂ OH
C	N	N	N	C	Me	OMe

RU 2 1 2 5 0 5 3 C 1

RU 2 1 2 5 0 5 3 C 1

Таблица 4 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b
C	N	N	N	C	Me	SMe
C	N	N	N	C	Me	Cl
C	N	N	N	C	Me	CF ₃
C	N	N	N	C	Me	Ph
C	N	N	N	C	Et	H
C	N	N	N	C	Et	Me
C	N	N	N	C	Et	Et
C	N	N	N	C	Et	n-Hex
C	N	N	N	C	Et	c-Pr
C	N	N	N	C	Et	c-Hex
C	N	N	N	C	Et	OH
C	N	N	N	C	Et	CH ₂ OH
C	N	N	N	C	Et	OMe
C	N	N	N	C	Et	SMe
C	N	N	N	C	Et	Cl
C	N	N	N	C	Et	CF ₃
C	N	N	N	C	Et	Ph
C	N	N	N	C	n-Pr	H
C	N	N	N	C	n-Pr	Me
C	N	N	N	C	n-Pr	Et
C	N	N	N	C	n-Pr	n-Hex
C	N	N	N	C	n-Pr	c-Pr
C	N	N	N	C	n-Pr	c-Hex
C	N	N	N	C	n-Pr	OH
C	N	N	N	C	n-Pr	CH ₂ OH
C	N	N	N	C	n-Pr	OMe
C	N	N	N	C	n-Pr	SMe
C	N	N	N	C	n-Pr	Cl
C	N	N	N	C	n-Pr	CF ₃
C	N	N	N	C	n-Pr	Ph
C	N	N	N	C	n-Hex	H
C	N	N	N	C	n-Hex	Me
C	N	N	N	C	n-Hex	Et
C	N	N	N	C	n-Hex	n-Hex
C	N	N	N	C	n-Hex	c-Pr
C	N	N	N	C	n-Hex	c-Hex
C	N	N	N	C	n-Hex	OH
C	N	N	N	C	n-Hex	CH ₂ OH
C	N	N	N	C	n-Hex	OMe
C	N	N	N	C	n-Hex	SMe
C	N	N	N	C	n-Hex	Cl
C	N	N	N	C	n-Hex	CF ₃
C	N	N	N	C	n-Hex	Ph
C	N	N	N	C	i-Pr	H

RU 2 1 2 5 0 5 3 C 1

RU 2 1 2 5 0 5 3 C 1

Таблица 4 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b
C	N	N	N	C	i-Pr	Me
C	N	N	N	C	i-Pr	Et
C	N	N	N	C	i-Pr	n-Hex
C	N	N	N	C	i-Pr	c-Pr
C	N	N	N	C	i-Pr	c-Hex
C	N	N	N	C	i-Pr	OH
C	N	N	N	C	i-Pr	CH ₂ OH
C	N	N	N	C	i-Pr	OMe
C	N	N	N	C	i-Pr	SMe
C	N	N	N	C	i-Pr	Cl
C	N	N	N	C	i-Pr	CF ₃
C	N	N	N	C	i-Pr	Ph
C	N	N	N	C	t-Bu	H
C	N	N	N	C	t-Bu	Me
C	N	N	N	C	t-Bu	Et
C	N	N	N	C	t-Bu	n-Hex
C	N	N	N	C	t-Bu	c-Pr
C	N	N	N	C	t-Bu	c-Hex
C	N	N	N	C	t-Bu	OH
C	N	N	N	C	t-Bu	CH ₂ OH
C	N	N	N	C	t-Bu	OMe
C	N	N	N	C	t-Bu	SMe
C	N	N	N	C	t-Bu	Cl
C	N	N	N	C	t-Bu	CF ₃
C	N	N	N	C	t-Bu	Ph
C	N	N	N	C	c-Hex	H
C	N	N	N	C	c-Hex	Me
C	N	N	N	C	c-Hex	Et
C	N	N	N	C	c-Hex	n-Hex
C	N	N	N	C	c-Hex	c-Pr
C	N	N	N	C	c-Hex	c-Hex
C	N	N	N	C	c-Hex	OH
C	N	N	N	C	c-Hex	CH ₂ OH
C	N	N	N	C	c-Hex	OMe
C	N	N	N	C	c-Hex	SMe
C	N	N	N	C	c-Hex	Cl
C	N	N	N	C	c-Hex	CF ₃
C	N	N	N	C	c-Hex	Ph
C	N	N	N	C	3-Ц-Гексенил	H
C	N	N	N	C	3-Ц-Гексенил	Me
C	N	N	N	C	3-Ц-Гексенил	Et
C	N	N	N	C	3-Ц-Гексенил	n-Hex
C	N	N	N	C	3-Ц-Гексенил	c-Pr
C	N	N	N	C	3-Ц-Гексенил	c-Hex

RU 2 1 2 5 0 5 3 C 1

RU 2 1 2 5 0 5 3 C 1

Таблица 4 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b
C	N	N	N	C	3-ц-гексенил	ОН
C	N	N	N	C	3-ц-гексенил	CH ₂ ОН
C	N	N	N	C	3-ц-гексенил	OMe
C	N	N	N	C	3-ц-гексенил	SMe
C	N	N	N	C	3-ц-гексенил	Cl
C	N	N	N	C	3-ц-гексенил	CF ₃
C	N	N	N	C	3-ц-гексенил	Ph
C	N	N	N	C	CH ₂ ОН	H
C	N	N	N	C	CH ₂ ОН	Me
C	N	N	N	C	CH ₂ ОН	Et
C	N	N	N	C	CH ₂ ОН	n-Hex
C	N	N	N	C	CH ₂ ОН	c-Pr
C	N	N	N	C	CH ₂ ОН	c-Hex
C	N	N	N	C	CH ₂ ОН	ОН
C	N	N	N	C	CH ₂ ОН	CH ₂ ОН
C	N	N	N	C	CH ₂ ОН	OMe
C	N	N	N	C	CH ₂ ОН	SMe
C	N	N	N	C	CH ₂ ОН	Cl
C	N	N	N	C	CH ₂ ОН	CF ₃
C	N	N	N	C	CH ₂ ОН	Ph
C	N	N	N	C	CH ₂ Ph	H
C	N	N	N	C	CH ₂ Ph	Me
C	N	N	N	C	CH ₂ Ph	Et
C	N	N	N	C	CH ₂ Ph	n-Hex
C	N	N	N	C	CH ₂ Ph	c-Pr
C	N	N	N	C	CH ₂ Ph	c-Hex
C	N	N	N	C	CH ₂ Ph	ОН
C	N	N	N	C	CH ₂ Ph	CH ₂ ОН
C	N	N	N	C	CH ₂ Ph	OMe
C	N	N	N	C	CH ₂ Ph	SMe
C	N	N	N	C	CH ₂ Ph	Cl
C	N	N	N	C	CH ₂ Ph	CF ₃
C	N	N	N	C	CH ₂ Ph	Ph
C	N	N	N	C	α-нафтил	H
C	N	N	N	C	α-нафтил	Me
C	N	N	N	C	α-нафтил	Et
C	N	N	N	C	α-нафтил	n-Hex
C	N	N	N	C	α-нафтил	c-Pr
C	N	N	N	C	α-нафтил	c-Hex
C	N	N	N	C	α-нафтил	ОН
C	N	N	N	C	α-нафтил	CH ₂ ОН
C	N	N	N	C	α-нафтил	OMe
C	N	N	N	C	α-нафтил	SMe
C	N	N	N	C	α-нафтил	Cl

RU 2125053 C1

RU 2125053 C1

Таблица 4 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b
C	N	N	N	C	α - нафтил	CF ₃
C	N	N	N	C	α - нафтил	Ph
C	N	N	N	C	β - нафтил	H
C	N	N	N	C	β - нафтил	Me
C	N	N	N	C	β - нафтил	Et
C	N	N	N	C	β - нафтил	n-Hex
C	N	N	N	C	β - нафтил	c-Pr
C	N	N	N	C	β - нафтил	c-Hex
C	N	N	N	C	β - нафтил	OH
C	N	N	N	C	β - нафтил	CH ₂ OH
C	N	N	N	C	β - нафтил	OMe
C	N	N	N	C	β - нафтил	SMe
C	N	N	N	C	β - нафтил	Cl
C	N	N	N	C	β - нафтил	CF ₃
C	N	N	N	C	β - нафтил	Ph
C	N	N	N	C	2-пиридил	H
C	N	N	N	C	2-пиридил	Me
C	N	N	N	C	2-пиридил	Et
C	N	N	N	C	2-пиридил	n-Hex
C	N	N	N	C	2-пиридил	c-Pr
C	N	N	N	C	2-пиридил	c-Hex
C	N	N	N	C	2-пиридил	OH
C	N	N	N	C	2-пиридил	CH ₂ OH
C	N	N	N	C	2-пиридил	OMe
C	N	N	N	C	2-пиридил	SMe
C	N	N	N	C	2-пиридил	Cl
C	N	N	N	C	2-пиридил	CF ₃
C	N	N	N	C	2-пиридил	Ph
C	N	N	N	C	3-пиридил	H
C	N	N	N	C	3-пиридил	Me
C	N	N	N	C	3-пиридил	Et
C	N	N	N	C	3-пиридил	n-Hex
C	N	N	N	C	3-пиридил	c-Pr
C	N	N	N	C	3-пиридил	c-Hex
C	N	N	N	C	3-пиридил	OH
C	N	N	N	C	3-пиридил	CH ₂ OH
C	N	N	N	C	3-пиридил	OMe
C	N	N	N	C	3-пиридил	SMe
C	N	N	N	C	3-пиридил	Cl
C	N	N	N	C	3-пиридил	CF ₃
C	N	N	N	C	3-пиридил	Ph
C	N	N	N	C	4-пиридил	H
C	N	N	N	C	4-пиридил	Me
C	N	N	N	C	4-пиридил	Et

RU 2125053 C1

RU 2125053 C1

Таблица 4 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b
C	N	N	N	C	4-пиридил	n-Hex
C	N	N	N	C	4-пиридил	c-Pr
C	N	N	N	C	4-пиридил	c-Hex
C	N	N	N	C	4-пиридил	OH
C	N	N	N	C	4-пиридил	CH ₂ OH
C	N	N	N	C	4-пиридил	OMe
C	N	N	N	C	4-пиридил	SMe
C	N	N	N	C	4-пиридил	Cl
C	N	N	N	C	4-пиридил	CF ₃
C	N	N	N	C	4-пиридил	Ph
C	N	N	N	C	2-фуранил	H
C	N	N	N	C	2-фуранил	Me
C	N	N	N	C	2-фуранил	Et
C	N	N	N	C	2-фуранил	n-Hex
C	N	N	N	C	2-фуранил	c-Pr
C	N	N	N	C	2-фуранил	c-Hex
C	N	N	N	C	2-фуранил	OH
C	N	N	N	C	2-фуранил	CH ₂ OH
C	N	N	N	C	2-фуранил	OMe
C	N	N	N	C	2-фуранил	SMe
C	N	N	N	C	2-фуранил	Cl
C	N	N	N	C	2-фуранил	CF ₃
C	N	N	N	C	2-фуранил	Ph
C	N	N	N	C	2-тиенил	H
C	N	N	N	C	2-тиенил	Me
C	N	N	N	C	2-тиенил	Et
C	N	N	N	C	2-тиенил	n-Hex
C	N	N	N	C	2-тиенил	c-Pr
C	N	N	N	C	2-тиенил	c-Hex
C	N	N	N	C	2-тиенил	OH
C	N	N	N	C	2-тиенил	CH ₂ OH
C	N	N	N	C	2-тиенил	OMe
C	N	N	N	C	2-тиенил	SMe
C	N	N	N	C	2-тиенил	Cl
C	N	N	N	C	2-тиенил	CF ₃
C	N	N	N	C	2-тиенил	Ph
C	N	N	N	C	2-толил	H
C	N	N	N	C	2-толил	Me
C	N	N	N	C	2-толил	Et
C	N	N	N	C	2-толил	n-Hex
C	N	N	N	C	2-толил	c-Pr
C	N	N	N	C	2-толил	c-Hex
C	N	N	N	C	2-толил	OH
C	N	N	N	C	2-толил	CH ₂ OH

RU 2 1 2 5 0 5 3 C 1

RU 2 1 2 5 0 5 3 C 1

Таблица 4 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b
C	N	N	N	C	2-ТОЛИЛ	OMe
C	N	N	N	C	2-ТОЛИЛ	SMe
C	N	N	N	C	2-ТОЛИЛ	Cl
C	N	N	N	C	2-ТОЛИЛ	CF ₃
C	N	N	N	C	2-ТОЛИЛ	Ph
C	N	N	N	C	3-ТОЛИЛ	H
C	N	N	N	C	3-ТОЛИЛ	Me
C	N	N	N	C	3-ТОЛИЛ	Et
C	N	N	N	C	3-ТОЛИЛ	n-Hex
C	N	N	N	C	3-ТОЛИЛ	c-Pr
C	N	N	N	C	3-ТОЛИЛ	c-Hex
C	N	N	N	C	3-ТОЛИЛ	OH
C	N	N	N	C	3-ТОЛИЛ	CH ₂ OH
C	N	N	N	C	3-ТОЛИЛ	OMe
C	N	N	N	C	3-ТОЛИЛ	SMe
C	N	N	N	C	3-ТОЛИЛ	Cl
C	N	N	N	C	3-ТОЛИЛ	CF ₃
C	N	N	N	C	3-ТОЛИЛ	Ph
C	N	N	N	C	4-ТОЛИЛ	H
C	N	N	N	C	4-ТОЛИЛ	Me
C	N	N	N	C	4-ТОЛИЛ	Et
C	N	N	N	C	4-ТОЛИЛ	n-Hex
C	N	N	N	C	4-ТОЛИЛ	c-Pr
C	N	N	N	C	4-ТОЛИЛ	c-Hex
C	N	N	N	C	4-ТОЛИЛ	OH
C	N	N	N	C	4-ТОЛИЛ	CH ₂ OH
C	N	N	N	C	4-ТОЛИЛ	OMe
C	N	N	N	C	4-ТОЛИЛ	SMe
C	N	N	N	C	4-ТОЛИЛ	Cl
C	N	N	N	C	4-ТОЛИЛ	CF ₃
C	N	N	N	C	4-ТОЛИЛ	Ph
C	N	N	N	C	Ph-2,3-Me ₂	H
C	N	N	N	C	Ph-2,3-Me ₂	Me
C	N	N	N	C	Ph-2,3-Me ₂	Et
C	N	N	N	C	Ph-2,3-Me ₂	n-Hex
C	N	N	N	C	Ph-2,3-Me ₂	c-Pr
C	N	N	N	C	Ph-2,3-Me ₂	c-Hex
C	N	N	N	C	Ph-2,3-Me ₂	OH
C	N	N	N	C	Ph-2,3-Me ₂	CH ₂ OH
C	N	N	N	C	Ph-2,3-Me ₂	OMe
C	N	N	N	C	Ph-2,3-Me ₂	SMe
C	N	N	N	C	Ph-2,3-Me ₂	Cl
C	N	N	N	C	Ph-2,3-Me ₂	CF ₃
C	N	N	N	C	Ph-2,3-Me ₂	Ph

RU 2 1 2 5 0 5 3 C 1

RU 2 1 2 5 0 5 3 C 1

Таблица 4 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b
C	N	N	N	C	Ph-3,4-Me ₂	H
C	N	N	N	C	Ph-3,4-Me ₂	Me
C	N	N	N	C	Ph-3,4-Me ₂	Et
C	N	N	N	C	Ph-3,4-Me ₂	n-Hex
C	N	N	N	C	Ph-3,4-Me ₂	c-Pr
C	N	N	N	C	Ph-3,4-Me ₂	c-Hex
C	N	N	N	C	Ph-3,4-Me ₂	OH
C	N	N	N	C	Ph-3,4-Me ₂	CH ₂ OH
C	N	N	N	C	Ph-3,4-Me ₂	OMe
C	N	N	N	C	Ph-3,4-Me ₂	SMe
C	N	N	N	C	Ph-3,4-Me ₂	Cl
C	N	N	N	C	Ph-3,4-Me ₂	CF ₃
C	N	N	N	C	Ph-3,4-Me ₂	Ph
C	N	N	N	C	Ph-3,5-Me ₂	H
C	N	N	N	C	Ph-3,5-Me ₂	Me
C	N	N	N	C	Ph-3,5-Me ₂	Et
C	N	N	N	C	Ph-3,5-Me ₂	n-Hex
C	N	N	N	C	Ph-3,5-Me ₂	c-Pr
C	N	N	N	C	Ph-3,5-Me ₂	c-Hex
C	N	N	N	C	Ph-3,5-Me ₂	OH
C	N	N	N	C	Ph-3,5-Me ₂	CH ₂ OH
C	N	N	N	C	Ph-3,5-Me ₂	OMe
C	N	N	N	C	Ph-3,5-Me ₂	SMe
C	N	N	N	C	Ph-3,5-Me ₂	Cl
C	N	N	N	C	Ph-3,5-Me ₂	CF ₃
C	N	N	N	C	Ph-3,5-Me ₂	Ph
C	N	N	N	C	Ph-2,6-Me ₂	H
C	N	N	N	C	Ph-2,6-Me ₂	Me
C	N	N	N	C	Ph-2,6-Me ₂	Et
C	N	N	N	C	Ph-2,6-Me ₂	n-Hex
C	N	N	N	C	Ph-2,6-Me ₂	c-Pr
C	N	N	N	C	Ph-2,6-Me ₂	c-Hex
C	N	N	N	C	Ph-2,6-Me ₂	OH
C	N	N	N	C	Ph-2,6-Me ₂	CH ₂ OH
C	N	N	N	C	Ph-2,6-Me ₂	OMe
C	N	N	N	C	Ph-2,6-Me ₂	SMe
C	N	N	N	C	Ph-2,6-Me ₂	Cl
C	N	N	N	C	Ph-2,6-Me ₂	CF ₃
C	N	N	N	C	Ph-2,6-Me ₂	Ph
C	N	N	N	C	Ph-2-Cl	H
C	N	N	N	C	Ph-2-Cl	Me
C	N	N	N	C	Ph-2-Cl	Et
C	N	N	N	C	Ph-2-Cl	n-Hex
C	N	N	N	C	Ph-2-Cl	c-Pr

RU 2125053 C1

RU 2125053 C1

Таблица 4 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b
C	N	N	N	C	Ph-2-Cl	c-Hex
C	N	N	N	C	Ph-2-Cl	OH
C	N	N	N	C	Ph-2-Cl	CH ₂ OH
C	N	N	N	C	Ph-2-Cl	OMe
C	N	N	N	C	Ph-2-Cl	SMe
C	N	N	N	C	Ph-2-Cl	Cl
C	N	N	N	C	Ph-2-Cl	CF ₃
C	N	N	N	C	Ph-2-Cl	Ph
C	N	N	N	C	Ph-3-Cl	H
C	N	N	N	C	Ph-3-Cl	Me
C	N	N	N	C	Ph-3-Cl	Et
C	N	N	N	C	Ph-3-Cl	n-Hex
C	N	N	N	C	Ph-3-Cl	c-Pr
C	N	N	N	C	Ph-3-Cl	c-Hex
C	N	N	N	C	Ph-3-Cl	OH
C	N	N	N	C	Ph-3-Cl	CH ₂ OH
C	N	N	N	C	Ph-3-Cl	OMe
C	N	N	N	C	Ph-3-Cl	SMe
C	N	N	N	C	Ph-3-Cl	Cl
C	N	N	N	C	Ph-3-Cl	CF ₃
C	N	N	N	C	Ph-3-Cl	Ph
C	N	N	N	C	Ph-4-Cl	H
C	N	N	N	C	Ph-4-Cl	Me
C	N	N	N	C	Ph-4-Cl	Et
C	N	N	N	C	Ph-4-Cl	n-Hex
C	N	N	N	C	Ph-4-Cl	c-Pr
C	N	N	N	C	Ph-4-Cl	c-Hex
C	N	N	N	C	Ph-4-Cl	OH
C	N	N	N	C	Ph-4-Cl	CH ₂ OH
C	N	N	N	C	Ph-4-Cl	OMe
C	N	N	N	C	Ph-4-Cl	SMe
C	N	N	N	C	Ph-4-Cl	Cl
C	N	N	N	C	Ph-4-Cl	CF ₃
C	N	N	N	C	Ph-4-Cl	Ph
C	N	N	N	C	Ph-3,4-Cl ₂	H
C	N	N	N	C	Ph-3,4-Cl ₂	Me
C	N	N	N	C	Ph-3,4-Cl ₂	Et
C	N	N	N	C	Ph-3,4-Cl ₂	n-Hex
C	N	N	N	C	Ph-3,4-Cl ₂	c-Pr
C	N	N	N	C	Ph-3,4-Cl ₂	c-Hex
C	N	N	N	C	Ph-3,4-Cl ₂	OH
C	N	N	N	C	Ph-3,4-Cl ₂	CH ₂ OH
C	N	N	N	C	Ph-3,4-Cl ₂	OMe
C	N	N	N	C	Ph-3,4-Cl ₂	SMe

RU 2 1 2 5 0 5 3 C 1

RU 2 1 2 5 0 5 3 C 1

Таблица 4 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b
C	N	N	N	C	Ph-3,4-Cl ₂	Cl
C	N	N	N	C	Ph-3,4-Cl ₂	CF ₃
C	N	N	N	C	Ph-3,4-Cl ₂	Ph
C	N	N	N	C	Ph-4-F	H
C	N	N	N	C	Ph-4-F	Me
C	N	N	N	C	Ph-4-F	Et
C	N	N	N	C	Ph-4-F	n-Hex
C	N	N	N	C	Ph-4-F	c-Pr
C	N	N	N	C	Ph-4-F	c-Hex
C	N	N	N	C	Ph-4-F	OH
C	N	N	N	C	Ph-4-F	CH ₂ OH
C	N	N	N	C	Ph-4-F	OMe
C	N	N	N	C	Ph-4-F	SMe
C	N	N	N	C	Ph-4-F	Cl
C	N	N	N	C	Ph-4-F	CF ₃
C	N	N	N	C	Ph-4-F	Ph
C	N	N	N	C	Ph-4-Br	H
C	N	N	N	C	Ph-4-Br	Me
C	N	N	N	C	Ph-4-Br	Et
C	N	N	N	C	Ph-4-Br	n-Hex
C	N	N	N	C	Ph-4-Br	c-Pr
C	N	N	N	C	Ph-4-Br	c-Hex
C	N	N	N	C	Ph-4-Br	OH
C	N	N	N	C	Ph-4-Br	CH ₂ OH
C	N	N	N	C	Ph-4-Br	OMe
C	N	N	N	C	Ph-4-Br	SMe
C	N	N	N	C	Ph-4-Br	Cl
C	N	N	N	C	Ph-4-Br	CF ₃
C	N	N	N	C	Ph-4-Br	Ph
C	N	N	N	C	Ph-2-OMe	H
C	N	N	N	C	Ph-2-OMe	Me
C	N	N	N	C	Ph-2-OMe	Et
C	N	N	N	C	Ph-2-OMe	n-Hex
C	N	N	N	C	Ph-2-OMe	c-Pr
C	N	N	N	C	Ph-2-OMe	c-Hex
C	N	N	N	C	Ph-2-OMe	OH
C	N	N	N	C	Ph-2-OMe	CH ₂ OH
C	N	N	N	C	Ph-2-OMe	OMe
C	N	N	N	C	Ph-2-OMe	SMe
C	N	N	N	C	Ph-2-OMe	Cl
C	N	N	N	C	Ph-2-OMe	CF ₃
C	N	N	N	C	Ph-2-OMe	Ph
C	N	N	N	C	Ph-3-OMe	H
C	N	N	N	C	Ph-3-OMe	Me

RU 2125053 C1

RU 2125053 C1

Таблица 4 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b
C	N	N	N	C	Ph-3-OMe	Et
C	N	N	N	C	Ph-3-OMe	n-Hex
C	N	N	N	C	Ph-3-OMe	c-Pr
C	N	N	N	C	Ph-3-OMe	c-Hex
C	N	N	N	C	Ph-3-OMe	OH
C	N	N	N	C	Ph-3-OMe	CH ₂ OH
C	N	N	N	C	Ph-3-OMe	OMe
C	N	N	N	C	Ph-3-OMe	SMe
C	N	N	N	C	Ph-3-OMe	Cl
C	N	N	N	C	Ph-3-OMe	CF ₃
C	N	N	N	C	Ph-3-OMe	Ph
C	N	N	N	C	Ph-4-OMe	H
C	N	N	N	C	Ph-4-OMe	Me
C	N	N	N	C	Ph-4-OMe	Et
C	N	N	N	C	Ph-4-OMe	n-Hex
C	N	N	N	C	Ph-4-OMe	c-Pr
C	N	N	N	C	Ph-4-OMe	c-Hex
C	N	N	N	C	Ph-4-OMe	OH
C	N	N	N	C	Ph-4-OMe	CH ₂ OH
C	N	N	N	C	Ph-4-OMe	OMe
C	N	N	N	C	Ph-4-OMe	SMe
C	N	N	N	C	Ph-4-OMe	Cl
C	N	N	N	C	Ph-4-OMe	CF ₃
C	N	N	N	C	Ph-4-OMe	Ph
C	N	N	N	C	Ph-3,4-(OMe) ₂	H
C	N	N	N	C	Ph-3,4-(OMe) ₂	Me
C	N	N	N	C	Ph-3,4-(OMe) ₂	Et
C	N	N	N	C	Ph-3,4-(OMe) ₂	n-Hex
C	N	N	N	C	Ph-3,4-(OMe) ₂	c-Pr
C	N	N	N	C	Ph-3,4-(OMe) ₂	c-Hex
C	N	N	N	C	Ph-3,4-(OMe) ₂	OH
C	N	N	N	C	Ph-3,4-(OMe) ₂	CH ₂ OH
C	N	N	N	C	Ph-3,4-(OMe) ₂	OMe
C	N	N	N	C	Ph-3,4-(OMe) ₂	SMe
C	N	N	N	C	Ph-3,4-(OMe) ₂	Cl
C	N	N	N	C	Ph-3,4-(OMe) ₂	CF ₃
C	N	N	N	C	Ph-3,4-(OMe) ₂	Ph
C	N	N	N	C	Ph-2-OH	H
C	N	N	N	C	Ph-2-OH	Me
C	N	N	N	C	Ph-2-OH	Et
C	N	N	N	C	Ph-2-OH	n-Hex
C	N	N	N	C	Ph-2-OH	c-Pr
C	N	N	N	C	Ph-2-OH	c-Hex
C	N	N	N	C	Ph-2-OH	OH

RU 2 1 2 5 0 5 3 C 1

RU 2 1 2 5 0 5 3 C 1

Таблица 4 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b
C	N	N	N	C	Ph-2-OH	CH ₂ OH
C	N	N	N	C	Ph-2-OH	OMe
C	N	N	N	C	Ph-2-OH	SMe
C	N	N	N	C	Ph-2-OH	Cl
C	N	N	N	C	Ph-2-OH	CF ₃
C	N	N	N	C	Ph-2-OH	Ph
C	N	N	N	C	Ph-3-OH	H
C	N	N	N	C	Ph-3-OH	Me
C	N	N	N	C	Ph-3-OH	Et
C	N	N	N	C	Ph-3-OH	n-Hex
C	N	N	N	C	Ph-3-OH	c-Pr
C	N	N	N	C	Ph-3-OH	c-Hex
C	N	N	N	C	Ph-3-OH	OH
C	N	N	N	C	Ph-3-OH	CH ₂ OH
C	N	N	N	C	Ph-3-OH	OMe
C	N	N	N	C	Ph-3-OH	SMe
C	N	N	N	C	Ph-3-OH	Cl
C	N	N	N	C	Ph-3-OH	CF ₃
C	N	N	N	C	Ph-3-OH	Ph
C	N	N	N	C	Ph-4-OH	H
C	N	N	N	C	Ph-4-OH	Me
C	N	N	N	C	Ph-4-OH	Et
C	N	N	N	C	Ph-4-OH	n-Hex
C	N	N	N	C	Ph-4-OH	c-Pr
C	N	N	N	C	Ph-4-OH	c-Hex
C	N	N	N	C	Ph-4-OH	OH
C	N	N	N	C	Ph-4-OH	CH ₂ OH
C	N	N	N	C	Ph-4-OH	OMe
C	N	N	N	C	Ph-4-OH	SMe
C	N	N	N	C	Ph-4-OH	Cl
C	N	N	N	C	Ph-4-OH	CF ₃
C	N	N	N	C	Ph-4-OH	Ph
C	N	N	N	C	Ph-3,4-(OH) ₂	H
C	N	N	N	C	Ph-3,4-(OH) ₂	Me
C	N	N	N	C	Ph-3,4-(OH) ₂	Et
C	N	N	N	C	Ph-3,4-(OH) ₂	n-Hex
C	N	N	N	C	Ph-3,4-(OH) ₂	c-Pr
C	N	N	N	C	Ph-3,4-(OH) ₂	c-Hex
C	N	N	N	C	Ph-3,4-(OH) ₂	OH
C	N	N	N	C	Ph-3,4-(OH) ₂	CH ₂ OH
C	N	N	N	C	Ph-3,4-(OH) ₂	OMe
C	N	N	N	C	Ph-3,4-(OH) ₂	SMe
C	N	N	N	C	Ph-3,4-(OH) ₂	Cl
C	N	N	N	C	Ph-3,4-(OH) ₂	CF ₃

RU 2 1 2 5 0 5 3 C 1

RU 2 1 2 5 0 5 3 C 1

Таблица 4 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b
C	N	N	N	C	Ph-3,4-(OH) ₂	Ph
C	N	N	N	C	Ph-3-SMe	H
C	N	N	N	C	Ph-3-SMe	Me
C	N	N	N	C	Ph-3-SMe	Et
C	N	N	N	C	Ph-3-SMe	n-Hex
C	N	N	N	C	Ph-3-SMe	c-Pr
C	N	N	N	C	Ph-3-SMe	c-Hex
C	N	N	N	C	Ph-3-SMe	OH
C	N	N	N	C	Ph-3-SMe	CH ₂ OH
C	N	N	N	C	Ph-3-SMe	OMe
C	N	N	N	C	Ph-3-SMe	SMe
C	N	N	N	C	Ph-3-SMe	Cl
C	N	N	N	C	Ph-3-SMe	CF ₃
C	N	N	N	C	Ph-3-SMe	Ph
C	N	N	N	C	Ph-3-CF ₃	H
C	N	N	N	C	Ph-3-CF ₃	Me
C	N	N	N	C	Ph-3-CF ₃	Et
C	N	N	N	C	Ph-3-CF ₃	n-Hex
C	N	N	N	C	Ph-3-CF ₃	c-Pr
C	N	N	N	C	Ph-3-CF ₃	c-Hex
C	N	N	N	C	Ph-3-CF ₃	OH
C	N	N	N	C	Ph-3-CF ₃	CH ₂ OH
C	N	N	N	C	Ph-3-CF ₃	OMe
C	N	N	N	C	Ph-3-CF ₃	SMe
C	N	N	N	C	Ph-3-CF ₃	Cl
C	N	N	N	C	Ph-3-CF ₃	CF ₃
C	N	N	N	C	Ph-3-CF ₃	Ph
C	N	N	N	C	Ph-3-NO ₂	H
C	N	N	N	C	Ph-3-NO ₂	Me
C	N	N	N	C	Ph-3-NO ₂	Et
C	N	N	N	C	Ph-3-NO ₂	n-Hex
C	N	N	N	C	Ph-3-NO ₂	c-Pr
C	N	N	N	C	Ph-3-NO ₂	c-Hex
C	N	N	N	C	Ph-3-NO ₂	OH
C	N	N	N	C	Ph-3-NO ₂	CH ₂ OH
C	N	N	N	C	Ph-3-NO ₂	OMe
C	N	N	N	C	Ph-3-NO ₂	SMe
C	N	N	N	C	Ph-3-NO ₂	Cl
C	N	N	N	C	Ph-3-NO ₂	CF ₃
C	N	N	N	C	Ph-3-NO ₂	Ph
C	N	N	N	C	Ph-4-NMe ₂	H
C	N	N	N	C	Ph-4-NMe ₂	Me
C	N	N	N	C	Ph-4-NMe ₂	Et
C	N	N	N	C	Ph-4-NMe ₂	n-Hex

RU 2 1 2 5 0 5 3 C 1

RU 2 1 2 5 0 5 3 C 1

Таблица 4 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b
C	N	N	N	C	Ph-4-NMe ₂	c-Pr
C	N	N	N	C	Ph-4-NMe ₂	c-Hex
C	N	N	N	C	Ph-4-NMe ₂	OH
C	N	N	N	C	Ph-4-NMe ₂	CH ₂ OH
C	N	N	N	C	Ph-4-NMe ₂	OMe
C	N	N	N	C	Ph-4-NMe ₂	SMe
C	N	N	N	C	Ph-4-NMe ₂	Cl
C	N	N	N	C	Ph-4-NMe ₂	CF ₃
C	N	N	N	C	Ph-4-NMe ₂	Ph
C	N	C	N	N	Ph	H
C	N	C	N	N	Ph	Me
C	N	C	N	N	Ph	Et
C	N	C	N	N	Ph	n-Hex
C	N	C	N	N	Ph	c-Pr
C	N	C	N	N	Ph	c-Hex
C	N	C	N	N	Ph	OH
C	N	C	N	N	Ph	CH ₂ OH
C	N	C	N	N	Ph	OMe
C	N	C	N	N	Ph	SMe
C	N	C	N	N	Ph	Cl
C	N	C	N	N	Ph	CF ₃
C	N	C	N	N	Ph	Ph
C	N	C	N	N	H	H
C	N	C	N	N	H	Me
C	N	C	N	N	H	Et
C	N	C	N	N	H	n-Hex
C	N	C	N	N	H	c-Pr
C	N	C	N	N	H	c-Hex
C	N	C	N	N	H	OH
C	N	C	N	N	H	CH ₂ OH
C	N	C	N	N	H	OMe
C	N	C	N	N	H	SMe
C	N	C	N	N	H	Cl
C	N	C	N	N	H	CF ₃
C	N	C	N	N	H	Ph
C	N	C	N	N	Me	H
C	N	C	N	N	Me	Me
C	N	C	N	N	Me	Et
C	N	C	N	N	Me	n-Hex
C	N	C	N	N	Me	c-Pr
C	N	C	N	N	Me	c-Hex
C	N	C	N	N	Me	OH
C	N	C	N	N	Me	CH ₂ OH
C	N	C	N	N	Me	OMe

RU 2125053 C1

RU 2125053 C1

Таблица 4 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b
C	N	C	N	N	Me	SMe
C	N	C	N	N	Me	Cl
C	N	C	N	N	Me	CF ₃
C	N	C	N	N	Me	Ph
C	N	C	N	N	Et	H
C	N	C	N	N	Et	Me
C	N	C	N	N	Et	Et
C	N	C	N	N	Et	n-Hex
C	N	C	N	N	Et	c-Pr
C	N	C	N	N	Et	c-Hex
C	N	C	N	N	Et	OH
C	N	C	N	N	Et	CH ₂ OH
C	N	C	N	N	Et	OMe
C	N	C	N	N	Et	SMe
C	N	C	N	N	Et	Cl
C	N	C	N	N	Et	CF ₃
C	N	C	N	N	Et	Ph
C	N	C	N	N	n-Pr	H
C	N	C	N	N	n-Pr	Me
C	N	C	N	N	n-Pr	Et
C	N	C	N	N	n-Pr	n-Hex
C	N	C	N	N	n-Pr	c-Pr
C	N	C	N	N	n-Pr	c-Hex
C	N	C	N	N	n-Pr	OH
C	N	C	N	N	n-Pr	CH ₂ OH
C	N	C	N	N	n-Pr	OMe
C	N	C	N	N	n-Pr	SMe
C	N	C	N	N	n-Pr	Cl
C	N	C	N	N	n-Pr	CF ₃
C	N	C	N	N	n-Pr	Ph
C	N	C	N	N	n-Hex	H
C	N	C	N	N	n-Hex	Me
C	N	C	N	N	n-Hex	Et
C	N	C	N	N	n-Hex	n-Hex
C	N	C	N	N	n-Hex	c-Pr
C	N	C	N	N	n-Hex	c-Hex
C	N	C	N	N	n-Hex	OH
C	N	C	N	N	n-Hex	CH ₂ OH
C	N	C	N	N	n-Hex	OMe
C	N	C	N	N	n-Hex	SMe
C	N	C	N	N	n-Hex	Cl
C	N	C	N	N	n-Hex	CF ₃
C	N	C	N	N	n-Hex	Ph
C	N	C	N	N	i-Pr	H

RU 2125053 C1

RU 2125053 C1

Таблица 4 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b
C	N	C	N	N	Me	SMe
C	N	C	N	N	Me	Cl
C	N	C	N	N	Me	CF ₃
C	N	C	N	N	Me	Ph
C	N	C	N	N	Et	H
C	N	C	N	N	Et	Me
C	N	C	N	N	Et	Et
C	N	C	N	N	Et	n-Hex
C	N	C	N	N	Et	c-Pr
C	N	C	N	N	Et	c-Hex
C	N	C	N	N	Et	OH
C	N	C	N	N	Et	CH ₂ OH
C	N	C	N	N	Et	OMe
C	N	C	N	N	Et	SMe
C	N	C	N	N	Et	Cl
C	N	C	N	N	Et	CF ₃
C	N	C	N	N	Et	Ph
C	N	C	N	N	n-Pr	H
C	N	C	N	N	n-Pr	Me
C	N	C	N	N	n-Pr	Et
C	N	C	N	N	n-Pr	n-Hex
C	N	C	N	N	n-Pr	c-Pr
C	N	C	N	N	n-Pr	c-Hex
C	N	C	N	N	n-Pr	OH
C	N	C	N	N	n-Pr	CH ₂ OH
C	N	C	N	N	n-Pr	OMe
C	N	C	N	N	n-Pr	SMe
C	N	C	N	N	n-Pr	Cl
C	N	C	N	N	n-Pr	CF ₃
C	N	C	N	N	n-Pr	Ph
C	N	C	N	N	n-Hex	H
C	N	C	N	N	n-Hex	Me
C	N	C	N	N	n-Hex	Et
C	N	C	N	N	n-Hex	n-Hex
C	N	C	N	N	n-Hex	c-Pr
C	N	C	N	N	n-Hex	c-Hex
C	N	C	N	N	n-Hex	OH
C	N	C	N	N	n-Hex	CH ₂ OH
C	N	C	N	N	n-Hex	OMe
C	N	C	N	N	n-Hex	SMe
C	N	C	N	N	n-Hex	Cl
C	N	C	N	N	n-Hex	CF ₃
C	N	C	N	N	n-Hex	Ph
C	N	C	N	N	i-Pr	H

RU 2125053 C1

RU 2125053 C1

Таблица 4 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b
C	N	C	N	N	i-Pr	Me
C	N	C	N	N	i-Pr	Et
C	N	C	N	N	i-Pr	n-Hex
C	N	C	N	N	i-Pr	c-Pr
C	N	C	N	N	i-Pr	c-Hex
C	N	C	N	N	i-Pr	OH
C	N	C	N	N	i-Pr	CH ₂ OH
C	N	C	N	N	i-Pr	OMe
C	N	C	N	N	i-Pr	SMe
C	N	C	N	N	i-Pr	Cl
C	N	C	N	N	i-Pr	CF ₃
C	N	C	N	N	i-Pr	Ph
C	N	C	N	N	t-Bu	H
C	N	C	N	N	t-Bu	Me
C	N	C	N	N	t-Bu	Et
C	N	C	N	N	t-Bu	n-Hex
C	N	C	N	N	t-Bu	c-Pr
C	N	C	N	N	t-Bu	c-Hex
C	N	C	N	N	t-Bu	OH
C	N	C	N	N	t-Bu	CH ₂ OH
C	N	C	N	N	t-Bu	OMe
C	N	C	N	N	t-Bu	SMe
C	N	C	N	N	t-Bu	Cl
C	N	C	N	N	t-Bu	CF ₃
C	N	C	N	N	t-Bu	Ph
C	N	C	N	N	c-Hex	H
C	N	C	N	N	c-Hex	Me
C	N	C	N	N	c-Hex	Et
C	N	C	N	N	c-Hex	n-Hex
C	N	C	N	N	c-Hex	c-Pr
C	N	C	N	N	c-Hex	c-Hex
C	N	C	N	N	c-Hex	OH
C	N	C	N	N	c-Hex	CH ₂ OH
C	N	C	N	N	c-Hex	OMe
C	N	C	N	N	c-Hex	SMe
C	N	C	N	N	c-Hex	Cl
C	N	C	N	N	c-Hex	CF ₃
C	N	C	N	N	c-Hex	Ph
C	N	C	N	N	3-ц-гексенил	H
C	N	C	N	N	3-ц-гексенил	Me
C	N	C	N	N	3-ц-гексенил	Et
C	N	C	N	N	3-ц-гексенил	n-Hex
C	N	C	N	N	3-ц-гексенил	c-Pr
C	N	C	N	N	3-ц-гексенил	c-Hex

RU 2 1 2 5 0 5 3 C 1

RU 2 1 2 5 0 5 3 C 1

Таблица 4 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b
C	N	C	N	N	3-ц-гексенил	OH
C	N	C	N	N	3-ц-гексенил	CH ₂ OH
C	N	C	N	N	3-ц-гексенил	OMe
C	N	C	N	N	3-ц-гексенил	SMe
C	N	C	N	N	3-ц-гексенил	Cl
C	N	C	N	N	3-ц-гексенил	CF ₃
C	N	C	N	N	3-ц-гексенил	Ph
C	N	C	N	N	CH ₂ OH	H
C	N	C	N	N	CH ₂ OH	Me
C	N	C	N	N	CH ₂ OH	Et
C	N	C	N	N	CH ₂ OH	n-Hex
C	N	C	N	N	CH ₂ OH	c-Pr
C	N	C	N	N	CH ₂ OH	c-Hex
C	N	C	N	N	CH ₂ OH	OH
C	N	C	N	N	CH ₂ OH	CH ₂ OH
C	N	C	N	N	CH ₂ OH	OMe
C	N	C	N	N	CH ₂ OH	SMe
C	N	C	N	N	CH ₂ OH	Cl
C	N	C	N	N	CH ₂ OH	CF ₃
C	N	C	N	N	CH ₂ OH	Ph
C	N	C	N	N	CH ₂ Ph	H
C	N	C	N	N	CH ₂ Ph	Me
C	N	C	N	N	CH ₂ Ph	Et
C	N	C	N	N	CH ₂ Ph	n-Hex
C	N	C	N	N	CH ₂ Ph	c-Pr
C	N	C	N	N	CH ₂ Ph	c-Hex
C	N	C	N	N	CH ₂ Ph	OH
C	N	C	N	N	CH ₂ Ph	CH ₂ OH
C	N	C	N	N	CH ₂ Ph	OMe
C	N	C	N	N	CH ₂ Ph	SMe
C	N	C	N	N	CH ₂ Ph	Cl
C	N	C	N	N	CH ₂ Ph	CF ₃
C	N	C	N	N	CH ₂ Ph	Ph
C	N	C	N	N	α-нафтил	H
C	N	C	N	N	α-нафтил	Me
C	N	C	N	N	α-нафтил	Et
C	N	C	N	N	α-нафтил	n-Hex
C	N	C	N	N	α-нафтил	c-Pr
C	N	C	N	N	α-нафтил	c-Hex
C	N	C	N	N	α-нафтил	OH
C	N	C	N	N	α-нафтил	CH ₂ OH
C	N	C	N	N	α-нафтил	OMe
C	N	C	N	N	α-нафтил	SMe
C	N	C	N	N	α-нафтил	Cl

RU 2125053 C1

RU 2125053 C1

Таблица 4 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b
C	N	C	N	N	α -нафтил	CF ₃
C	N	C	N	N	α -нафтил	Ph
C	N	C	N	N	β -нафтил	H
C	N	C	N	N	β -нафтил	Me
C	N	C	N	N	β -нафтил	Et
C	N	C	N	N	β -нафтил	n-Hex
C	N	C	N	N	β -нафтил	c-Pr
C	N	C	N	N	β -нафтил	c-Hex
C	N	C	N	N	β -нафтил	OH
C	N	C	N	N	β -нафтил	CH ₂ OH
C	N	C	N	N	β -нафтил	OMe
C	N	C	N	N	β -нафтил	SMe
C	N	C	N	N	β -нафтил	Cl
C	N	C	N	N	β -нафтил	CF ₃
C	N	C	N	N	β -нафтил	Ph
C	N	C	N	N	2-пиридил	H
C	N	C	N	N	2-пиридил	Me
C	N	C	N	N	2-пиридил	Et
C	N	C	N	N	2-пиридил	n-Hex
C	N	C	N	N	2-пиридил	c-Pr
C	N	C	N	N	2-пиридил	c-Hex
C	N	C	N	N	2-пиридил	OH
C	N	C	N	N	2-пиридил	CH ₂ OH
C	N	C	N	N	2-пиридил	OMe
C	N	C	N	N	2-пиридил	SMe
C	N	C	N	N	2-пиридил	Cl
C	N	C	N	N	2-пиридил	CF ₃
C	N	C	N	N	2-пиридил	Ph
C	N	C	N	N	3-пиридил	H
C	N	C	N	N	3-пиридил	Me
C	N	C	N	N	3-пиридил	Et
C	N	C	N	N	3-пиридил	n-Hex
C	N	C	N	N	3-пиридил	c-Pr
C	N	C	N	N	3-пиридил	c-Hex
C	N	C	N	N	3-пиридил	OH
C	N	C	N	N	3-пиридил	CH ₂ OH
C	N	C	N	N	3-пиридил	OMe
C	N	C	N	N	3-пиридил	SMe
C	N	C	N	N	3-пиридил	Cl
C	N	C	N	N	3-пиридил	CF ₃
C	N	C	N	N	3-пиридил	Ph
C	N	C	N	N	4-пиридил	H
C	N	C	N	N	4-пиридил	Me
C	N	C	N	N	4-пиридил	Et

RU 2 1 2 5 0 5 3 C 1

RU 2 1 2 5 0 5 3 C 1

Таблица 4 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b
C	N	C	N	N	4-пиридил	n-Hex
C	N	C	N	N	4-пиридил	c-Pr
C	N	C	N	N	4-пиридил	c-Hex
C	N	C	N	N	4-пиридил	OH
C	N	C	N	N	4-пиридил	CH ₂ OH
C	N	C	N	N	4-пиридил	OMe
C	N	C	N	N	4-пиридил	SMe
C	N	C	N	N	4-пиридил	Cl
C	N	C	N	N	4-пиридил	CF ₃
C	N	C	N	N	4-пиридил	Ph
C	N	C	N	N	2-фуранил	H
C	N	C	N	N	2-фуранил	Me
C	N	C	N	N	2-фуранил	Et
C	N	C	N	N	2-фуранил	n-Hex
C	N	C	N	N	2-фуранил	c-Pr
C	N	C	N	N	2-фуранил	c-Hex
C	N	C	N	N	2-фуранил	OH
C	N	C	N	N	2-фуранил	CH ₂ OH
C	N	C	N	N	2-фуранил	OMe
C	N	C	N	N	2-фуранил	SMe
C	N	C	N	N	2-фуранил	Cl
C	N	C	N	N	2-фуранил	CF ₃
C	N	C	N	N	2-фуранил	Ph
C	N	C	N	N	2-тиенил	H
C	N	C	N	N	2-тиенил	Me
C	N	C	N	N	2-тиенил	Et
C	N	C	N	N	2-тиенил	n-Hex
C	N	C	N	N	2-тиенил	c-Pr
C	N	C	N	N	2-тиенил	c-Hex
C	N	C	N	N	2-тиенил	OH
C	N	C	N	N	2-тиенил	CH ₂ OH
C	N	C	N	N	2-тиенил	OMe
C	N	C	N	N	2-тиенил	SMe
C	N	C	N	N	2-тиенил	Cl
C	N	C	N	N	2-тиенил	CF ₃
C	N	C	N	N	2-тиенил	Ph
C	N	C	N	N	2-толил	H
C	N	C	N	N	2-толил	Me
C	N	C	N	N	2-толил	Et
C	N	C	N	N	2-толил	n-Hex
C	N	C	N	N	2-толил	c-Pr
C	N	C	N	N	2-толил	c-Hex
C	N	C	N	N	2-толил	OH
C	N	C	N	N	2-толил	CH ₂ OH

RU 2125053 C1

RU 2125053 C1

Таблица 4 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b
C	N	C	N	N	2-ТОЛИЛ	OMe
C	N	C	N	N	2-ТОЛИЛ	SMe
C	N	C	N	N	2-ТОЛИЛ	Cl
C	N	C	N	N	2-ТОЛИЛ	CF ₃
C	N	C	N	N	2-ТОЛИЛ	Ph
C	N	C	N	N	3-ТОЛИЛ	H
C	N	C	N	N	3-ТОЛИЛ	Me
C	N	C	N	N	3-ТОЛИЛ	Et
C	N	C	N	N	3-ТОЛИЛ	n-Hex
C	N	C	N	N	3-ТОЛИЛ	c-Pr
C	N	C	N	N	3-ТОЛИЛ	c-Hex
C	N	C	N	N	3-ТОЛИЛ	OH
C	N	C	N	N	3-ТОЛИЛ	CH ₂ OH
C	N	C	N	N	3-ТОЛИЛ	OMe
C	N	C	N	N	3-ТОЛИЛ	SMe
C	N	C	N	N	3-ТОЛИЛ	Cl
C	N	C	N	N	3-ТОЛИЛ	CF ₃
C	N	C	N	N	3-ТОЛИЛ	Ph
C	N	C	N	N	4-ТОЛИЛ	H
C	N	C	N	N	4-ТОЛИЛ	Me
C	N	C	N	N	4-ТОЛИЛ	Et
C	N	C	N	N	4-ТОЛИЛ	n-Hex
C	N	C	N	N	4-ТОЛИЛ	c-Pr
C	N	C	N	N	4-ТОЛИЛ	c-Hex
C	N	C	N	N	4-ТОЛИЛ	OH
C	N	C	N	N	4-ТОЛИЛ	CH ₂ OH
C	N	C	N	N	4-ТОЛИЛ	OMe
C	N	C	N	N	4-ТОЛИЛ	SMe
C	N	C	N	N	4-ТОЛИЛ	Cl
C	N	C	N	N	4-ТОЛИЛ	CF ₃
C	N	C	N	N	4-ТОЛИЛ	Ph
C	N	C	N	N	Ph-2,3-Me ₂	H
C	N	C	N	N	Ph-2,3-Me ₂	Me
C	N	C	N	N	Ph-2,3-Me ₂	Et
C	N	C	N	N	Ph-2,3-Me ₂	n-Hex
C	N	C	N	N	Ph-2,3-Me ₂	c-Pr
C	N	C	N	N	Ph-2,3-Me ₂	c-Hex
C	N	C	N	N	Ph-2,3-Me ₂	OH
C	N	C	N	N	Ph-2,3-Me ₂	CH ₂ OH
C	N	C	N	N	Ph-2,3-Me ₂	OMe
C	N	C	N	N	Ph-2,3-Me ₂	SMe
C	N	C	N	N	Ph-2,3-Me ₂	Cl
C	N	C	N	N	Ph-2,3-Me ₂	CF ₃
C	N	C	N	N	Ph-2,3-Me ₂	Ph

RU 2 1 2 5 0 5 3 C 1

RU 2 1 2 5 0 5 3 C 1

Таблица 4 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b
C	N	C	N	N	Ph-3,4-Me ₂	H
C	N	C	N	N	Ph-3,4-Me ₂	Me
C	N	C	N	N	Ph-3,4-Me ₂	Et
C	N	C	N	N	Ph-3,4-Me ₂	n-Hex
C	N	C	N	N	Ph-3,4-Me ₂	c-Pr
C	N	C	N	N	Ph-3,4-Me ₂	c-Hex
C	N	C	N	N	Ph-3,4-Me ₂	OH
C	N	C	N	N	Ph-3,4-Me ₂	CH ₂ OH
C	N	C	N	N	Ph-3,4-Me ₂	OMe
C	N	C	N	N	Ph-3,4-Me ₂	SMe
C	N	C	N	N	Ph-3,4-Me ₂	Cl
C	N	C	N	N	Ph-3,4-Me ₂	CF ₃
C	N	C	N	N	Ph-3,4-Me ₂	Ph
C	N	C	N	N	Ph-3,5-Me ₂	H
C	N	C	N	N	Ph-3,5-Me ₂	Me
C	N	C	N	N	Ph-3,5-Me ₂	Et
C	N	C	N	N	Ph-3,5-Me ₂	n-Hex
C	N	C	N	N	Ph-3,5-Me ₂	c-Pr
C	N	C	N	N	Ph-3,5-Me ₂	c-Hex
C	N	C	N	N	Ph-3,5-Me ₂	OH
C	N	C	N	N	Ph-3,5-Me ₂	CH ₂ OH
C	N	C	N	N	Ph-3,5-Me ₂	OMe
C	N	C	N	N	Ph-3,5-Me ₂	SMe
C	N	C	N	N	Ph-3,5-Me ₂	Cl
C	N	C	N	N	Ph-3,5-Me ₂	CF ₃
C	N	C	N	N	Ph-3,5-Me ₂	Ph
C	N	C	N	N	Ph-2,6-Me ₂	H
C	N	C	N	N	Ph-2,6-Me ₂	Me
C	N	C	N	N	Ph-2,6-Me ₂	Et
C	N	C	N	N	Ph-2,6-Me ₂	n-Hex
C	N	C	N	N	Ph-2,6-Me ₂	c-Pr
C	N	C	N	N	Ph-2,6-Me ₂	c-Hex
C	N	C	N	N	Ph-2,6-Me ₂	OH
C	N	C	N	N	Ph-2,6-Me ₂	CH ₂ OH
C	N	C	N	N	Ph-2,6-Me ₂	OMe
C	N	C	N	N	Ph-2,6-Me ₂	SMe
C	N	C	N	N	Ph-2,6-Me ₂	Cl
C	N	C	N	N	Ph-2,6-Me ₂	CF ₃
C	N	C	N	N	Ph-2,6-Me ₂	Ph
C	N	C	N	N	Ph-2-Cl	H
C	N	C	N	N	Ph-2-Cl	Me
C	N	C	N	N	Ph-2-Cl	Et
C	N	C	N	N	Ph-2-Cl	n-Hex
C	N	C	N	N	Ph-2-Cl	c-Pr

RU 2125053 C1

RU 2125053 C1

Таблица 4 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b
C	N	C	N	N	Ph-2-Cl	c-Hex
C	N	C	N	N	Ph-2-Cl	OH
C	N	C	N	N	Ph-2-Cl	CH ₂ OH
C	N	C	N	N	Ph-2-Cl	OMe
C	N	C	N	N	Ph-2-Cl	SMe
C	N	C	N	N	Ph-2-Cl	Cl
C	N	C	N	N	Ph-2-Cl	CF ₃
C	N	C	N	N	Ph-2-Cl	Ph
C	N	C	N	N	Ph-3-Cl	H
C	N	C	N	N	Ph-3-Cl	Me
C	N	C	N	N	Ph-3-Cl	Et
C	N	C	N	N	Ph-3-Cl	n-Hex
C	N	C	N	N	Ph-3-Cl	c-Pr
C	N	C	N	N	Ph-3-Cl	c-Hex
C	N	C	N	N	Ph-3-Cl	OH
C	N	C	N	N	Ph-3-Cl	CH ₂ OH
C	N	C	N	N	Ph-3-Cl	OMe
C	N	C	N	N	Ph-3-Cl	SMe
C	N	C	N	N	Ph-3-Cl	Cl
C	N	C	N	N	Ph-3-Cl	CF ₃
C	N	C	N	N	Ph-3-Cl	Ph
C	N	C	N	N	Ph-4-Cl	H
C	N	C	N	N	Ph-4-Cl	Me
C	N	C	N	N	Ph-4-Cl	Et
C	N	C	N	N	Ph-4-Cl	n-Hex
C	N	C	N	N	Ph-4-Cl	c-Pr
C	N	C	N	N	Ph-4-Cl	c-Hex
C	N	C	N	N	Ph-4-Cl	OH
C	N	C	N	N	Ph-4-Cl	CH ₂ OH
C	N	C	N	N	Ph-4-Cl	OMe
C	N	C	N	N	Ph-4-Cl	SMe
C	N	C	N	N	Ph-4-Cl	Cl
C	N	C	N	N	Ph-4-Cl	CF ₃
C	N	C	N	N	Ph-4-Cl	Ph
C	N	C	N	N	Ph-3,4-Cl ₂	H
C	N	C	N	N	Ph-3,4-Cl ₂	Me
C	N	C	N	N	Ph-3,4-Cl ₂	Et
C	N	C	N	N	Ph-3,4-Cl ₂	n-Hex
C	N	C	N	N	Ph-3,4-Cl ₂	c-Pr
C	N	C	N	N	Ph-3,4-Cl ₂	c-Hex
C	N	C	N	N	Ph-3,4-Cl ₂	OH
C	N	C	N	N	Ph-3,4-Cl ₂	CH ₂ OH
C	N	C	N	N	Ph-3,4-Cl ₂	OMe
C	N	C	N	N	Ph-3,4-Cl ₂	SMe

RU 2125053 C1

RU 2125053 C1

Таблица 4 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b
C	N	C	N	N	Ph-3,4-Cl ₂	Cl
C	N	C	N	N	Ph-3,4-Cl ₂	CF ₃
C	N	C	N	N	Ph-3,4-Cl ₂	Ph
C	N	C	N	N	Ph-4-F	H
C	N	C	N	N	Ph-4-F	Me
C	N	C	N	N	Ph-4-F	Et
C	N	C	N	N	Ph-4-F	n-Hex
C	N	C	N	N	Ph-4-F	c-Pr
C	N	C	N	N	Ph-4-F	c-Hex
C	N	C	N	N	Ph-4-F	OH
C	N	C	N	N	Ph-4-F	CH ₂ OH
C	N	C	N	N	Ph-4-F	OMe
C	N	C	N	N	Ph-4-F	SMe
C	N	C	N	N	Ph-4-F	Cl
C	N	C	N	N	Ph-4-F	CF ₃
C	N	C	N	N	Ph-4-F	Ph
C	N	C	N	N	Ph-4-Br	H
C	N	C	N	N	Ph-4-Br	Me
C	N	C	N	N	Ph-4-Br	Et
C	N	C	N	N	Ph-4-Br	n-Hex
C	N	C	N	N	Ph-4-Br	c-Pr
C	N	C	N	N	Ph-4-Br	c-Hex
C	N	C	N	N	Ph-4-Br	OH
C	N	C	N	N	Ph-4-Br	CH ₂ OH
C	N	C	N	N	Ph-4-Br	OMe
C	N	C	N	N	Ph-4-Br	SMe
C	N	C	N	N	Ph-4-Br	Cl
C	N	C	N	N	Ph-4-Br	CF ₃
C	N	C	N	N	Ph-4-Br	Ph
C	N	C	N	N	Ph-2-OMe	H
C	N	C	N	N	Ph-2-OMe	Me
C	N	C	N	N	Ph-2-OMe	Et
C	N	C	N	N	Ph-2-OMe	n-Hex
C	N	C	N	N	Ph-2-OMe	c-Pr
C	N	C	N	N	Ph-2-OMe	c-Hex
C	N	C	N	N	Ph-2-OMe	OH
C	N	C	N	N	Ph-2-OMe	CH ₂ OH
C	N	C	N	N	Ph-2-OMe	OMe
C	N	C	N	N	Ph-2-OMe	SMe
C	N	C	N	N	Ph-2-OMe	Cl
C	N	C	N	N	Ph-2-OMe	CF ₃
C	N	C	N	N	Ph-2-OMe	Ph
C	N	C	N	N	Ph-3-OMe	H
C	N	C	N	N	Ph-3-OMe	Me

RU 2125053 C1

RU 2125053 C1

Таблица 4 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b
C	N	C	N	N	Ph-3-OMe	Et
C	N	C	N	N	Ph-3-OMe	n-Hex
C	N	C	N	N	Ph-3-OMe	c-Pr
C	N	C	N	N	Ph-3-OMe	c-Hex
C	N	C	N	N	Ph-3-OMe	OH
C	N	C	N	N	Ph-3-OMe	CH ₂ OH
C	N	C	N	N	Ph-3-OMe	OMe
C	N	C	N	N	Ph-3-OMe	SMe
C	N	C	N	N	Ph-3-OMe	Cl
C	N	C	N	N	Ph-3-OMe	CF ₃
C	N	C	N	N	Ph-3-OMe	Ph
C	N	C	N	N	Ph-4-OMe	H
C	N	C	N	N	Ph-4-OMe	Me
C	N	C	N	N	Ph-4-OMe	Et
C	N	C	N	N	Ph-4-OMe	n-Hex
C	N	C	N	N	Ph-4-OMe	c-Pr
C	N	C	N	N	Ph-4-OMe	c-Hex
C	N	C	N	N	Ph-4-OMe	OH
C	N	C	N	N	Ph-4-OMe	CH ₂ OH
C	N	C	N	N	Ph-4-OMe	OMe
C	N	C	N	N	Ph-4-OMe	SMe
C	N	C	N	N	Ph-4-OMe	Cl
C	N	C	N	N	Ph-4-OMe	CF ₃
C	N	C	N	N	Ph-4-OMe	Ph
C	N	C	N	N	Ph-3,4-(OMe) ₂	H
C	N	C	N	N	Ph-3,4-(OMe) ₂	Me
C	N	C	N	N	Ph-3,4-(OMe) ₂	Et
C	N	C	N	N	Ph-3,4-(OMe) ₂	n-Hex
C	N	C	N	N	Ph-3,4-(OMe) ₂	c-Pr
C	N	C	N	N	Ph-3,4-(OMe) ₂	c-Hex
C	N	C	N	N	Ph-3,4-(OMe) ₂	OH
C	N	C	N	N	Ph-3,4-(OMe) ₂	CH ₂ OH
C	N	C	N	N	Ph-3,4-(OMe) ₂	OMe
C	N	C	N	N	Ph-3,4-(OMe) ₂	SMe
C	N	C	N	N	Ph-3,4-(OMe) ₂	Cl
C	N	C	N	N	Ph-3,4-(OMe) ₂	CF ₃
C	N	C	N	N	Ph-3,4-(OMe) ₂	Ph
C	N	C	N	N	Ph-2-OH	H
C	N	C	N	N	Ph-2-OH	Me
C	N	C	N	N	Ph-2-OH	Et
C	N	C	N	N	Ph-2-OH	n-Hex
C	N	C	N	N	Ph-2-OH	c-Pr
C	N	C	N	N	Ph-2-OH	c-Hex
C	N	C	N	N	Ph-2-OH	OH

Таблица 4 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b
C	N	C	N	N	Ph-2-OH	CH ₂ OH
C	N	C	N	N	Ph-2-OH	OMe
C	N	C	N	N	Ph-2-OH	SMe
C	N	C	N	N	Ph-2-OH	Cl
C	N	C	N	N	Ph-2-OH	CF ₃
C	N	C	N	N	Ph-2-OH	Ph
C	N	C	N	N	Ph-3-OH	H
C	N	C	N	N	Ph-3-OH	Me
C	N	C	N	N	Ph-3-OH	Et
C	N	C	N	N	Ph-3-OH	n-Hex
C	N	C	N	N	Ph-3-OH	c-Pr
C	N	C	N	N	Ph-3-OH	c-Hex
C	N	C	N	N	Ph-3-OH	OH
C	N	C	N	N	Ph-3-OH	CH ₂ OH
C	N	C	N	N	Ph-3-OH	OMe
C	N	C	N	N	Ph-3-OH	SMe
C	N	C	N	N	Ph-3-OH	Cl
C	N	C	N	N	Ph-3-OH	CF ₃
C	N	C	N	N	Ph-3-OH	Ph
C	N	C	N	N	Ph-4-OH	H
C	N	C	N	N	Ph-4-OH	Me
C	N	C	N	N	Ph-4-OH	Et
C	N	C	N	N	Ph-4-OH	n-Hex
C	N	C	N	N	Ph-4-OH	c-Pr
C	N	C	N	N	Ph-4-OH	c-Hex
C	N	C	N	N	Ph-4-OH	OH
C	N	C	N	N	Ph-4-OH	CH ₂ OH
C	N	C	N	N	Ph-4-OH	OMe
C	N	C	N	N	Ph-4-OH	SMe
C	N	C	N	N	Ph-4-OH	Cl
C	N	C	N	N	Ph-4-OH	CF ₃
C	N	C	N	N	Ph-4-OH	Ph
C	N	C	N	N	Ph-3,4-(OH) ₂	H
C	N	C	N	N	Ph-3,4-(OH) ₂	Me
C	N	C	N	N	Ph-3,4-(OH) ₂	Et
C	N	C	N	N	Ph-3,4-(OH) ₂	n-Hex
C	N	C	N	N	Ph-3,4-(OH) ₂	c-Pr
C	N	C	N	N	Ph-3,4-(OH) ₂	c-Hex
C	N	C	N	N	Ph-3,4-(OH) ₂	OH
C	N	C	N	N	Ph-3,4-(OH) ₂	CH ₂ OH
C	N	C	N	N	Ph-3,4-(OH) ₂	OMe
C	N	C	N	N	Ph-3,4-(OH) ₂	SMe
C	N	C	N	N	Ph-3,4-(OH) ₂	Cl
C	N	C	N	N	Ph-3,4-(OH) ₂	CF ₃

RU 2125053 C1

RU 2125053 C1

Таблица 4 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b
C	N	C	N	N	Ph-3,4-(OH) ₂	Ph
C	N	C	N	N	Ph-3-SMe	H
C	N	C	N	N	Ph-3-SMe	Me
C	N	C	N	N	Ph-3-SMe	Et
C	N	C	N	N	Ph-3-SMe	n-Hex
C	N	C	N	N	Ph-3-SMe	c-Pr
C	N	C	N	N	Ph-3-SMe	c-Hex
C	N	C	N	N	Ph-3-SMe	OH
C	N	C	N	N	Ph-3-SMe	CH ₂ OH
C	N	C	N	N	Ph-3-SMe	OMe
C	N	C	N	N	Ph-3-SMe	SMe
C	N	C	N	N	Ph-3-SMe	Cl
C	N	C	N	N	Ph-3-SMe	CF ₃
C	N	C	N	N	Ph-3-SMe	Ph
C	N	C	N	N	Ph-3-CF ₃	H
C	N	C	N	N	Ph-3-CF ₃	Me
C	N	C	N	N	Ph-3-CF ₃	Et
C	N	C	N	N	Ph-3-CF ₃	n-Hex
C	N	C	N	N	Ph-3-CF ₃	c-Pr
C	N	C	N	N	Ph-3-CF ₃	c-Hex
C	N	C	N	N	Ph-3-CF ₃	OH
C	N	C	N	N	Ph-3-CF ₃	CH ₂ OH
C	N	C	N	N	Ph-3-CF ₃	OMe
C	N	C	N	N	Ph-3-CF ₃	SMe
C	N	C	N	N	Ph-3-CF ₃	Cl
C	N	C	N	N	Ph-3-CF ₃	CF ₃
C	N	C	N	N	Ph-3-CF ₃	Ph
C	N	C	N	N	Ph-3-NO ₂	H
C	N	C	N	N	Ph-3-NO ₂	Me
C	N	C	N	N	Ph-3-NO ₂	Et
C	N	C	N	N	Ph-3-NO ₂	n-Hex
C	N	C	N	N	Ph-3-NO ₂	c-Pr
C	N	C	N	N	Ph-3-NO ₂	c-Hex
C	N	C	N	N	Ph-3-NO ₂	OH
C	N	C	N	N	Ph-3-NO ₂	CH ₂ OH
C	N	C	N	N	Ph-3-NO ₂	OMe
C	N	C	N	N	Ph-3-NO ₂	SMe
C	N	C	N	N	Ph-3-NO ₂	Cl
C	N	C	N	N	Ph-3-NO ₂	CF ₃
C	N	C	N	N	Ph-3-NO ₂	Ph
C	N	C	N	N	Ph-4-NMe ₂	H
C	N	C	N	N	Ph-4-NMe ₂	Me
C	N	C	N	N	Ph-4-NMe ₂	Et
C	N	C	N	N	Ph-4-NMe ₂	n-Hex

RU 2125053 C1

RU 2125053 C1

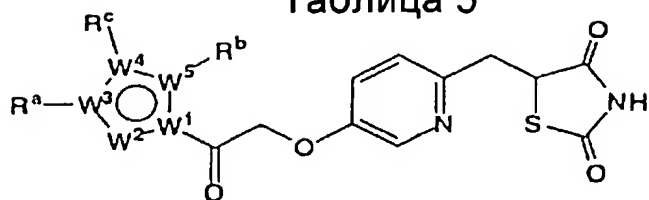
RU 2125053 C1

RU 2125053 C1

Таблица 4 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b
C	N	C	N	N	Ph-4-NMe ₂	c-Pr
C	N	C	N	N	Ph-4-NMe ₂	c-Hex
C	N	C	N	N	Ph-4-NMe ₂	OH
C	N	C	N	N	Ph-4-NMe ₂	CH ₂ OH
C	N	C	N	N	Ph-4-NMe ₂	OMe
C	N	C	N	N	Ph-4-NMe ₂	SMe
C	N	C	N	N	Ph-4-NMe ₂	Cl
C	N	C	N	N	Ph-4-NMe ₂	CF ₃
C	N	C	N	N	Ph-4-NMe ₂	Ph

Таблица 5



W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b	R ^c
C	N	C	C	N	Ph	Me	Me
C	N	C	C	N	Ph	Me	Et
C	N	C	C	N	Ph	Me	n-Hex
C	N	C	C	N	Ph	Me	c-Pr
C	N	C	C	N	Ph	Me	c-Hex
C	N	C	C	N	Ph	Me	OH
C	N	C	C	N	Ph	Me	CH ₂ OH
C	N	C	C	N	Ph	Me	OMe
C	N	C	C	N	Ph	Me	SMe
C	N	C	C	N	Ph	Me	Cl
C	N	C	C	N	Ph	Me	CF ₃
C	N	C	C	N	Ph	Me	Ph
C	N	C	C	N	Ph	Me	H
C	N	C	C	N	H	Me	Me
C	N	C	C	N	H	Me	Et
C	N	C	C	N	H	Me	n-Hex
C	N	C	C	N	H	Me	c-Pr
C	N	C	C	N	H	Me	c-Hex
C	N	C	C	N	H	Me	OH
C	N	C	C	N	H	Me	CH ₂ OH
C	N	C	C	N	H	Me	OMe
C	N	C	C	N	H	Me	SMe
C	N	C	C	N	H	Me	Cl
C	N	C	C	N	H	Me	CF ₃
C	N	C	C	N	H	Me	Ph
C	N	C	C	N	Me	Me	H
C	N	C	C	N	Me	Me	Me
C	N	C	C	N	Me	Me	Et
C	N	C	C	N	Me	Me	n-Hex
C	N	C	C	N	Me	Me	c-Pr
C	N	C	C	N	Me	Me	c-Hex
C	N	C	C	N	Me	Me	OH
C	N	C	C	N	Me	Me	CH ₂ OH
C	N	C	C	N	Me	Me	OMe
C	N	C	C	N	Me	Me	SMe
C	N	C	C	N	Me	Me	Cl

RU 2125053 C1

RU 2125053 C1

Таблица 5 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b	R ^c
C	N	C	C	N	Me	Me	CF ₃
C	N	C	C	N	Me	Me	Ph
C	N	C	C	N	Et	Me	H
C	N	C	C	N	Et	Me	Me
C	N	C	C	N	Et	Me	Et
C	N	C	C	N	Et	Me	n-Hex
C	N	C	C	N	Et	Me	c-Pr
C	N	C	C	N	Et	Me	c-Hex
C	N	C	C	N	Et	Me	OH
C	N	C	C	N	Et	Me	CH ₂ OH
C	N	C	C	N	Et	Me	OMe
C	N	C	C	N	Et	Me	SMe
C	N	C	C	N	Et	Me	Cl
C	N	C	C	N	Et	Me	CF ₃
C	N	C	C	N	Et	Me	Ph
C	N	C	C	N	n-Pr	Me	H
C	N	C	C	N	n-Pr	Me	Me
C	N	C	C	N	n-Pr	Me	Et
C	N	C	C	N	n-Pr	Me	n-Hex
C	N	C	C	N	n-Pr	Me	c-Pr
C	N	C	C	N	n-Pr	Me	c-Hex
C	N	C	C	N	n-Pr	Me	OH
C	N	C	C	N	n-Pr	Me	CH ₂ OH
C	N	C	C	N	n-Pr	Me	OMe
C	N	C	C	N	n-Pr	Me	SMe
C	N	C	C	N	n-Pr	Me	Cl
C	N	C	C	N	n-Pr	Me	CF ₃
C	N	C	C	N	n-Pr	Me	Ph
C	N	C	C	N	n-Hex	Me	H
C	N	C	C	N	n-Hex	Me	Me
C	N	C	C	N	n-Hex	Me	Et
C	N	C	C	N	n-Hex	Me	n-Hex
C	N	C	C	N	n-Hex	Me	c-Pr
C	N	C	C	N	n-Hex	Me	c-Hex
C	N	C	C	N	n-Hex	Me	OH
C	N	C	C	N	n-Hex	Me	CH ₂ OH
C	N	C	C	N	n-Hex	Me	OMe
C	N	C	C	N	n-Hex	Me	SMe
C	N	C	C	N	n-Hex	Me	Cl
C	N	C	C	N	n-Hex	Me	CF ₃
C	N	C	C	N	n-Hex	Me	Ph
C	N	C	C	N	i-Pr	Me	H
C	N	C	C	N	i-Pr	Me	Me
C	N	C	C	N	i-Pr	Me	Et

RU 2125053 C1

RU 2125053 C1

Таблица 5 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b	R ^c
C	N	C	C	N	i-Pr	Me	n-Hex
C	N	C	C	N	i-Pr	Me	c-Pr
C	N	C	C	N	i-Pr	Me	c-Hex
C	N	C	C	N	i-Pr	Me	OH
C	N	C	C	N	i-Pr	Me	CH ₂ OH
C	N	C	C	N	i-Pr	Me	OMe
C	N	C	C	N	i-Pr	Me	SMe
C	N	C	C	N	i-Pr	Me	Cl
C	N	C	C	N	i-Pr	Me	CF ₃
C	N	C	C	N	i-Pr	Me	Ph
C	N	C	C	N	t-Bu	Me	H
C	N	C	C	N	t-Bu	Me	Me
C	N	C	C	N	t-Bu	Me	Et
C	N	C	C	N	t-Bu	Me	n-Hex
C	N	C	C	N	t-Bu	Me	c-Pr
C	N	C	C	N	t-Bu	Me	c-Hex
C	N	C	C	N	t-Bu	Me	OH
C	N	C	C	N	t-Bu	Me	CH ₂ OH
C	N	C	C	N	t-Bu	Me	OMe
C	N	C	C	N	t-Bu	Me	SMe
C	N	C	C	N	t-Bu	Me	Cl
C	N	C	C	N	t-Bu	Me	CF ₃
C	N	C	C	N	t-Bu	Me	Ph
C	N	C	C	N	c-Hex	Me	H
C	N	C	C	N	c-Hex	Me	Me
C	N	C	C	N	c-Hex	Me	Et
C	N	C	C	N	c-Hex	Me	n-Hex
C	N	C	C	N	c-Hex	Me	c-Pr
C	N	C	C	N	c-Hex	Me	c-Hex
C	N	C	C	N	c-Hex	Me	OH
C	N	C	C	N	c-Hex	Me	CH ₂ OH
C	N	C	C	N	c-Hex	Me	OMe
C	N	C	C	N	c-Hex	Me	SMe
C	N	C	C	N	c-Hex	Me	Cl
C	N	C	C	N	c-Hex	Me	CF ₃
C	N	C	C	N	c-Hex	Me	Ph
C	N	C	C	N	3-ц-гексенил	Me	H
C	N	C	C	N	3-ц-гексенил	Me	Me
C	N	C	C	N	3-ц-гексенил	Me	Et
C	N	C	C	N	3-ц-гексенил	Me	n-Hex
C	N	C	C	N	3-ц-гексенил	Me	c-Pr
C	N	C	C	N	3-ц-гексенил	Me	c-Hex
C	N	C	C	N	3-ц-гексенил	Me	OH
C	N	C	C	N	3-ц-гексенил	Me	CH ₂ OH

RU 2125053 C1

RU 2125053 C1

Таблица 5 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b	R ^c
C	N	C	C	N	3-ц-гексенил	Me	OMe
C	N	C	C	N	3-ц-гексенил	Me	SMe
C	N	C	C	N	3-ц-гексенил	Me	Cl
C	N	C	C	N	3-ц-гексенил	Me	CF ₃
C	N	C	C	N	3-ц-гексенил	Me	Ph
C	N	C	C	N	CH ₂ OH	Me	H
C	N	C	C	N	CH ₂ OH	Me	Me
C	N	C	C	N	CH ₂ OH	Me	Et
C	N	C	C	N	CH ₂ OH	Me	n-Hex
C	N	C	C	N	CH ₂ OH	Me	c-Pr
C	N	C	C	N	CH ₂ OH	Me	c-Hex
C	N	C	C	N	CH ₂ OH	Me	OH
C	N	C	C	N	CH ₂ OH	Me	CH ₂ OH
C	N	C	C	N	CH ₂ OH	Me	OMe
C	N	C	C	N	CH ₂ OH	Me	SMe
C	N	C	C	N	CH ₂ OH	Me	Cl
C	N	C	C	N	CH ₂ OH	Me	CF ₃
C	N	C	C	N	CH ₂ OH	Me	Ph
C	N	C	C	N	CH ₂ Ph	Me	H
C	N	C	C	N	CH ₂ Ph	Me	Me
C	N	C	C	N	CH ₂ Ph	Me	Et
C	N	C	C	N	CH ₂ Ph	Me	n-Hex
C	N	C	C	N	CH ₂ Ph	Me	c-Pr
C	N	C	C	N	CH ₂ Ph	Me	c-Hex
C	N	C	C	N	CH ₂ Ph	Me	OH
C	N	C	C	N	CH ₂ Ph	Me	CH ₂ OH
C	N	C	C	N	CH ₂ Ph	Me	OMe
C	N	C	C	N	CH ₂ Ph	Me	SMe
C	N	C	C	N	CH ₂ Ph	Me	Cl
C	N	C	C	N	CH ₂ Ph	Me	CF ₃
C	N	C	C	N	CH ₂ Ph	Me	Ph
C	N	C	C	N	α-нафтил	Me	H
C	N	C	C	N	α-нафтил	Me	Me
C	N	C	C	N	α-нафтил	Me	Et
C	N	C	C	N	α-нафтил	Me	n-Hex
C	N	C	C	N	α-нафтил	Me	c-Pr
C	N	C	C	N	α-нафтил	Me	c-Hex
C	N	C	C	N	α-нафтил	Me	OH
C	N	C	C	N	α-нафтил	Me	CH ₂ OH
C	N	C	C	N	α-нафтил	Me	OMe
C	N	C	C	N	α-нафтил	Me	SMe
C	N	C	C	N	α-нафтил	Me	Cl
C	N	C	C	N	α-нафтил	Me	CF ₃
C	N	C	C	N	α-нафтил	Me	Ph

RU 2125053 C1

RU 2125053 C1

Таблица 5 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b	R ^c
C	N	C	C	N	β - нафтил	Me	H
C	N	C	C	N	β - нафтил	Me	Me
C	N	C	C	N	β - нафтил	Me	Et
C	N	C	C	N	β - нафтил	Me	n-Hex
C	N	C	C	N	β - нафтил	Me	c-Pr
C	N	C	C	N	β - нафтил	Me	c-Hex
C	N	C	C	N	β - нафтил	Me	OH
C	N	C	C	N	β - нафтил	Me	CH ₂ OH
C	N	C	C	N	β - нафтил	Me	OMe
C	N	C	C	N	β - нафтил	Me	SMe
C	N	C	C	N	β - нафтил	Me	Cl
C	N	C	C	N	β - нафтил	Me	CF ₃
C	N	C	C	N	β - нафтил	Me	Ph
C	N	C	C	N	2-пиридил	Me	H
C	N	C	C	N	2-пиридил	Me	Me
C	N	C	C	N	2-пиридил	Me	Et
C	N	C	C	N	2-пиридил	Me	n-Hex
C	N	C	C	N	2-пиридил	Me	c-Pr
C	N	C	C	N	2-пиридил	Me	c-Hex
C	N	C	C	N	2-пиридил	Me	OH
C	N	C	C	N	2-пиридил	Me	CH ₂ OH
C	N	C	C	N	2-пиридил	Me	OMe
C	N	C	C	N	2-пиридил	Me	SMe
C	N	C	C	N	2-пиридил	Me	Cl
C	N	C	C	N	2-пиридил	Me	CF ₃
C	N	C	C	N	2-пиридил	Me	Ph
C	N	C	C	N	3-пиридил	Me	H
C	N	C	C	N	3-пиридил	Me	Me
C	N	C	C	N	3-пиридил	Me	Et
C	N	C	C	N	3-пиридил	Me	n-Hex
C	N	C	C	N	3-пиридил	Me	c-Pr
C	N	C	C	N	3-пиридил	Me	c-Hex
C	N	C	C	N	3-пиридил	Me	OH
C	N	C	C	N	3-пиридил	Me	CH ₂ OH
C	N	C	C	N	3-пиридил	Me	OMe
C	N	C	C	N	3-пиридил	Me	SMe
C	N	C	C	N	3-пиридил	Me	Cl
C	N	C	C	N	3-пиридил	Me	CF ₃
C	N	C	C	N	3-пиридил	Me	Ph
C	N	C	C	N	4-пиридил	Me	H
C	N	C	C	N	4-пиридил	Me	Me
C	N	C	C	N	4-пиридил	Me	Et
C	N	C	C	N	4-пиридил	Me	n-Hex
C	N	C	C	N	4-пиридил	Me	c-Pr

RU 2 1 2 5 0 5 3 C 1

RU 2 1 2 5 0 5 3 C 1

Таблица 5 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b	R ^c
C	N	C	C	N	4-пиридил	Me	c-Hex
C	N	C	C	N	4-пиридил	Me	OH
C	N	C	C	N	4-пиридил	Me	CH ₂ OH
C	N	C	C	N	4-пиридил	Me	OMe
C	N	C	C	N	4-пиридил	Me	SMe
C	N	C	C	N	4-пиридил	Me	Cl
C	N	C	C	N	4-пиридил	Me	CF ₃
C	N	C	C	N	4-пиридил	Me	Ph
C	N	C	C	N	2-фуранил	Me	H
C	N	C	C	N	2-фуранил	Me	Me
C	N	C	C	N	2-фуранил	Me	Et
C	N	C	C	N	2-фуранил	Me	n-Hex
C	N	C	C	N	2-фуранил	Me	c-Pr
C	N	C	C	N	2-фуранил	Me	c-Hex
C	N	C	C	N	2-фуранил	Me	OH
C	N	C	C	N	2-фуранил	Me	CH ₂ OH
C	N	C	C	N	2-фуранил	Me	OMe
C	N	C	C	N	2-фуранил	Me	SMe
C	N	C	C	N	2-фуранил	Me	Cl
C	N	C	C	N	2-фуранил	Me	CF ₃
C	N	C	C	N	2-фуранил	Me	Ph
C	N	C	C	N	2-тиенил	Me	H
C	N	C	C	N	2-тиенил	Me	Me
C	N	C	C	N	2-тиенил	Me	Et
C	N	C	C	N	2-тиенил	Me	n-Hex
C	N	C	C	N	2-тиенил	Me	c-Pr
C	N	C	C	N	2-тиенил	Me	c-Hex
C	N	C	C	N	2-тиенил	Me	OH
C	N	C	C	N	2-тиенил	Me	CH ₂ OH
C	N	C	C	N	2-тиенил	Me	OMe
C	N	C	C	N	2-тиенил	Me	SMe
C	N	C	C	N	2-тиенил	Me	Cl
C	N	C	C	N	2-тиенил	Me	CF ₃
C	N	C	C	N	2-тиенил	Me	Ph
C	N	C	C	N	2-толил	Me	H
C	N	C	C	N	2-толил	Me	Me
C	N	C	C	N	2-толил	Me	Et
C	N	C	C	N	2-толил	Me	n-Hex
C	N	C	C	N	2-толил	Me	c-Pr
C	N	C	C	N	2-толил	Me	c-Hex
C	N	C	C	N	2-толил	Me	OH
C	N	C	C	N	2-толил	Me	CH ₂ OH
C	N	C	C	N	2-толил	Me	OMe
C	N	C	C	N	2-толил	Me	SMe

RU 2125053 C1

RU 2125053 C1

Таблица 5 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b	R ^c
C	N	C	C	N	2-ТОЛИЛ	Me	Cl
C	N	C	C	N	2-ТОЛИЛ	Me	CF ₃
C	N	C	C	N	2-ТОЛИЛ	Me	Ph
C	N	C	C	N	3-ТОЛИЛ	Me	H
C	N	C	C	N	3-ТОЛИЛ	Me	Me
C	N	C	C	N	3-ТОЛИЛ	Me	Et
C	N	C	C	N	3-ТОЛИЛ	Me	n-Hex
C	N	C	C	N	3-ТОЛИЛ	Me	c-Pr
C	N	C	C	N	3-ТОЛИЛ	Me	c-Hex
C	N	C	C	N	3-ТОЛИЛ	Me	OH
C	N	C	C	N	3-ТОЛИЛ	Me	CH ₂ OH
C	N	C	C	N	3-ТОЛИЛ	Me	OMe
C	N	C	C	N	3-ТОЛИЛ	Me	SMe
C	N	C	C	N	3-ТОЛИЛ	Me	Cl
C	N	C	C	N	3-ТОЛИЛ	Me	CF ₃
C	N	C	C	N	3-ТОЛИЛ	Me	Ph
C	N	C	C	N	4-ТОЛИЛ	Me	H
C	N	C	C	N	4-ТОЛИЛ	Me	Me
C	N	C	C	N	4-ТОЛИЛ	Me	Et
C	N	C	C	N	4-ТОЛИЛ	Me	n-Hex
C	N	C	C	N	4-ТОЛИЛ	Me	c-Pr
C	N	C	C	N	4-ТОЛИЛ	Me	c-Hex
C	N	C	C	N	4-ТОЛИЛ	Me	OH
C	N	C	C	N	4-ТОЛИЛ	Me	CH ₂ OH
C	N	C	C	N	4-ТОЛИЛ	Me	OMe
C	N	C	C	N	4-ТОЛИЛ	Me	SMe
C	N	C	C	N	4-ТОЛИЛ	Me	Cl
C	N	C	C	N	4-ТОЛИЛ	Me	CF ₃
C	N	C	C	N	4-ТОЛИЛ	Me	Ph
C	N	C	C	N	Ph-2,3-Me ₂	Me	H
C	N	C	C	N	Ph-2,3-Me ₂	Me	Me
C	N	C	C	N	Ph-2,3-Me ₂	Me	Et
C	N	C	C	N	Ph-2,3-Me ₂	Me	n-Hex
C	N	C	C	N	Ph-2,3-Me ₂	Me	c-Pr
C	N	C	C	N	Ph-2,3-Me ₂	Me	c-Hex
C	N	C	C	N	Ph-2,3-Me ₂	Me	OH
C	N	C	C	N	Ph-2,3-Me ₂	Me	CH ₂ OH
C	N	C	C	N	Ph-2,3-Me ₂	Me	OMe
C	N	C	C	N	Ph-2,3-Me ₂	Me	SMe
C	N	C	C	N	Ph-2,3-Me ₂	Me	Cl
C	N	C	C	N	Ph-2,3-Me ₂	Me	CF ₃
C	N	C	C	N	Ph-2,3-Me ₂	Me	Ph
C	N	C	C	N	Ph-3,4-Me ₂	Me	H
C	N	C	C	N	Ph-3,4-Me ₂	Me	Me

RU 2125053 C1

RU 2125053 C1

Таблица 5 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b	R ^c
C	N	C	C	N	Ph-3,4-Me ₂	Me	Et
C	N	C	C	N	Ph-3,4-Me ₂	Me	n-Hex
C	N	C	C	N	Ph-3,4-Me ₂	Me	c-Pr
C	N	C	C	N	Ph-3,4-Me ₂	Me	c-Hex
C	N	C	C	N	Ph-3,4-Me ₂	Me	OH
C	N	C	C	N	Ph-3,4-Me ₂	Me	CH ₂ OH
C	N	C	C	N	Ph-3,4-Me ₂	Me	OMe
C	N	C	C	N	Ph-3,4-Me ₂	Me	SMe
C	N	C	C	N	Ph-3,4-Me ₂	Me	Cl
C	N	C	C	N	Ph-3,4-Me ₂	Me	CF ₃
C	N	C	C	N	Ph-3,4-Me ₂	Me	Ph
C	N	C	C	N	Ph-3,5-Me ₂	Me	H
C	N	C	C	N	Ph-3,5-Me ₂	Me	Me
C	N	C	C	N	Ph-3,5-Me ₂	Me	Et
C	N	C	C	N	Ph-3,5-Me ₂	Me	n-Hex
C	N	C	C	N	Ph-3,5-Me ₂	Me	c-Pr
C	N	C	C	N	Ph-3,5-Me ₂	Me	c-Hex
C	N	C	C	N	Ph-3,5-Me ₂	Me	OH
C	N	C	C	N	Ph-3,5-Me ₂	Me	CH ₂ OH
C	N	C	C	N	Ph-3,5-Me ₂	Me	OMe
C	N	C	C	N	Ph-3,5-Me ₂	Me	SMe
C	N	C	C	N	Ph-3,5-Me ₂	Me	Cl
C	N	C	C	N	Ph-3,5-Me ₂	Me	CF ₃
C	N	C	C	N	Ph-3,5-Me ₂	Me	Ph
C	N	C	C	N	Ph-2,6-Me ₂	Me	H
C	N	C	C	N	Ph-2,6-Me ₂	Me	Me
C	N	C	C	N	Ph-2,6-Me ₂	Me	Et
C	N	C	C	N	Ph-2,6-Me ₂	Me	n-Hex
C	N	C	C	N	Ph-2,6-Me ₂	Me	c-Pr
C	N	C	C	N	Ph-2,6-Me ₂	Me	c-Hex
C	N	C	C	N	Ph-2,6-Me ₂	Me	OH
C	N	C	C	N	Ph-2,6-Me ₂	Me	CH ₂ OH
C	N	C	C	N	Ph-2,6-Me ₂	Me	OMe
C	N	C	C	N	Ph-2,6-Me ₂	Me	SMe
C	N	C	C	N	Ph-2,6-Me ₂	Me	Cl
C	N	C	C	N	Ph-2,6-Me ₂	Me	CF ₃
C	N	C	C	N	Ph-2,6-Me ₂	Me	Ph
C	N	C	C	N	Ph-2-Cl	Me	H
C	N	C	C	N	Ph-2-Cl	Me	Me
C	N	C	C	N	Ph-2-Cl	Me	Et
C	N	C	C	N	Ph-2-Cl	Me	n-Hex
C	N	C	C	N	Ph-2-Cl	Me	c-Pr
C	N	C	C	N	Ph-2-Cl	Me	c-Hex
C	N	C	C	N	Ph-2-Cl	Me	OH

RU 2 1 2 5 0 5 3 C 1

RU 2 1 2 5 0 5 3 C 1

Таблица 5 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b	R ^c
C	N	C	C	N	Ph-2-Cl	Me	CH ₂ OH
C	N	C	C	N	Ph-2-Cl	Me	OMe
C	N	C	C	N	Ph-2-Cl	Me	SMe
C	N	C	C	N	Ph-2-Cl	Me	Cl
C	N	C	C	N	Ph-2-Cl	Me	CF ₃
C	N	C	C	N	Ph-2-Cl	Me	Ph
C	N	C	C	N	Ph-3-Cl	Me	H
C	N	C	C	N	Ph-3-Cl	Me	Me
C	N	C	C	N	Ph-3-Cl	Me	Et
C	N	C	C	N	Ph-3-Cl	Me	n-Hex
C	N	C	C	N	Ph-3-Cl	Me	c-Pr
C	N	C	C	N	Ph-3-Cl	Me	c-Hex
C	N	C	C	N	Ph-3-Cl	Me	OH
C	N	C	C	N	Ph-3-Cl	Me	CH ₂ OH
C	N	C	C	N	Ph-3-Cl	Me	OMe
C	N	C	C	N	Ph-3-Cl	Me	SMe
C	N	C	C	N	Ph-3-Cl	Me	Cl
C	N	C	C	N	Ph-3-Cl	Me	CF ₃
C	N	C	C	N	Ph-3-Cl	Me	Ph
C	N	C	C	N	Ph-4-Cl	Me	H
C	N	C	C	N	Ph-4-Cl	Me	Me
C	N	C	C	N	Ph-4-Cl	Me	Et
C	N	C	C	N	Ph-4-Cl	Me	n-Hex
C	N	C	C	N	Ph-4-Cl	Me	c-Pr
C	N	C	C	N	Ph-4-Cl	Me	c-Hex
C	N	C	C	N	Ph-4-Cl	Me	OH
C	N	C	C	N	Ph-4-Cl	Me	CH ₂ OH
C	N	C	C	N	Ph-4-Cl	Me	OMe
C	N	C	C	N	Ph-4-Cl	Me	SMe
C	N	C	C	N	Ph-4-Cl	Me	Cl
C	N	C	C	N	Ph-4-Cl	Me	CF ₃
C	N	C	C	N	Ph-4-Cl	Me	Ph
C	N	C	C	N	Ph-3,4-Cl ₂	Me	H
C	N	C	C	N	Ph-3,4-Cl ₂	Me	Me
C	N	C	C	N	Ph-3,4-Cl ₂	Me	Et
C	N	C	C	N	Ph-3,4-Cl ₂	Me	n-Hex
C	N	C	C	N	Ph-3,4-Cl ₂	Me	c-Pr
C	N	C	C	N	Ph-3,4-Cl ₂	Me	c-Hex
C	N	C	C	N	Ph-3,4-Cl ₂	Me	OH
C	N	C	C	N	Ph-3,4-Cl ₂	Me	CH ₂ OH
C	N	C	C	N	Ph-3,4-Cl ₂	Me	OMe
C	N	C	C	N	Ph-3,4-Cl ₂	Me	SMe
C	N	C	C	N	Ph-3,4-Cl ₂	Me	Cl
C	N	C	C	N	Ph-3,4-Cl ₂	Me	CF ₃

RU 2125053 C1

RU 2125053 C1

Таблица 5 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b	R ^c
C	N	C	C	N	Ph-3,4-Cl ₂	Me	Ph
C	N	C	C	N	Ph-4-F	Me	H
C	N	C	C	N	Ph-4-F	Me	Me
C	N	C	C	N	Ph-4-F	Me	Et
C	N	C	C	N	Ph-4-F	Me	n-Hex
C	N	C	C	N	Ph-4-F	Me	c-Pr
C	N	C	C	N	Ph-4-F	Me	c-Hex
C	N	C	C	N	Ph-4-F	Me	OH
C	N	C	C	N	Ph-4-F	Me	CH ₂ OH
C	N	C	C	N	Ph-4-F	Me	OMe
C	N	C	C	N	Ph-4-F	Me	SMe
C	N	C	C	N	Ph-4-F	Me	Cl
C	N	C	C	N	Ph-4-F	Me	CF ₃
C	N	C	C	N	Ph-4-F	Me	Ph
C	N	C	C	N	Ph-4-Br	Me	H
C	N	C	C	N	Ph-4-Br	Me	Me
C	N	C	C	N	Ph-4-Br	Me	Et
C	N	C	C	N	Ph-4-Br	Me	n-Hex
C	N	C	C	N	Ph-4-Br	Me	c-Pr
C	N	C	C	N	Ph-4-Br	Me	c-Hex
C	N	C	C	N	Ph-4-Br	Me	OH
C	N	C	C	N	Ph-4-Br	Me	CH ₂ OH
C	N	C	C	N	Ph-4-Br	Me	OMe
C	N	C	C	N	Ph-4-Br	Me	SMe
C	N	C	C	N	Ph-4-Br	Me	Cl
C	N	C	C	N	Ph-4-Br	Me	CF ₃
C	N	C	C	N	Ph-4-Br	Me	Ph
C	N	C	C	N	Ph-2-OMe	Me	H
C	N	C	C	N	Ph-2-OMe	Me	Me
C	N	C	C	N	Ph-2-OMe	Me	Et
C	N	C	C	N	Ph-2-OMe	Me	n-Hex
C	N	C	C	N	Ph-2-OMe	Me	c-Pr
C	N	C	C	N	Ph-2-OMe	Me	c-Hex
C	N	C	C	N	Ph-2-OMe	Me	OH
C	N	C	C	N	Ph-2-OMe	Me	CH ₂ OH
C	N	C	C	N	Ph-2-OMe	Me	OMe
C	N	C	C	N	Ph-2-OMe	Me	SMe
C	N	C	C	N	Ph-2-OMe	Me	Cl
C	N	C	C	N	Ph-2-OMe	Me	CF ₃
C	N	C	C	N	Ph-2-OMe	Me	Ph
C	N	C	C	N	Ph-3-OMe	Me	H
C	N	C	C	N	Ph-3-OMe	Me	Me
C	N	C	C	N	Ph-3-OMe	Me	Et
C	N	C	C	N	Ph-3-OMe	Me	n-Hex

RU 2 1 2 5 0 5 3 C 1

RU 2 1 2 5 0 5 3 C 1

Таблица 5 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b	R ^c
C	N	C	C	N	Ph-3-OMe	Me	c-Pr
C	N	C	C	N	Ph-3-OMe	Me	c-Hex
C	N	C	C	N	Ph-3-OMe	Me	OH
C	N	C	C	N	Ph-3-OMe	Me	CH ₂ OH
C	N	C	C	N	Ph-3-OMe	Me	OMe
C	N	C	C	N	Ph-3-OMe	Me	SMe
C	N	C	C	N	Ph-3-OMe	Me	Cl
C	N	C	C	N	Ph-3-OMe	Me	CF ₃
C	N	C	C	N	Ph-3-OMe	Me	Ph
C	N	C	C	N	Ph-4-OMe	Me	H
C	N	C	C	N	Ph-4-OMe	Me	Me
C	N	C	C	N	Ph-4-OMe	Me	Et
C	N	C	C	N	Ph-4-OMe	Me	n-Hex
C	N	C	C	N	Ph-4-OMe	Me	c-Pr
C	N	C	C	N	Ph-4-OMe	Me	c-Hex
C	N	C	C	N	Ph-4-OMe	Me	OH
C	N	C	C	N	Ph-4-OMe	Me	CH ₂ OH
C	N	C	C	N	Ph-4-OMe	Me	OMe
C	N	C	C	N	Ph-4-OMe	Me	SMe
C	N	C	C	N	Ph-4-OMe	Me	Cl
C	N	C	C	N	Ph-4-OMe	Me	CF ₃
C	N	C	C	N	Ph-4-OMe	Me	Ph
C	N	C	C	N	Ph-3,4-(OMe) ₂	Me	H
C	N	C	C	N	Ph-3,4-(OMe) ₂	Me	Me
C	N	C	C	N	Ph-3,4-(OMe) ₂	Me	Et
C	N	C	C	N	Ph-3,4-(OMe) ₂	Me	n-Hex
C	N	C	C	N	Ph-3,4-(OMe) ₂	Me	c-Pr
C	N	C	C	N	Ph-3,4-(OMe) ₂	Me	c-Hex
C	N	C	C	N	Ph-3,4-(OMe) ₂	Me	OH
C	N	C	C	N	Ph-3,4-(OMe) ₂	Me	CH ₂ OH
C	N	C	C	N	Ph-3,4-(OMe) ₂	Me	OMe
C	N	C	C	N	Ph-3,4-(OMe) ₂	Me	SMe
C	N	C	C	N	Ph-3,4-(OMe) ₂	Me	Cl
C	N	C	C	N	Ph-3,4-(OMe) ₂	Me	CF ₃
C	N	C	C	N	Ph-3,4-(OMe) ₂	Me	Ph
C	N	C	C	N	Ph-2-OH	Me	H
C	N	C	C	N	Ph-2-OH	Me	Me
C	N	C	C	N	Ph-2-OH	Me	Et
C	N	C	C	N	Ph-2-OH	Me	n-Hex
C	N	C	C	N	Ph-2-OH	Me	c-Pr
C	N	C	C	N	Ph-2-OH	Me	c-Hex
C	N	C	C	N	Ph-2-OH	Me	OH
C	N	C	C	N	Ph-2-OH	Me	CH ₂ OH
C	N	C	C	N	Ph-2-OH	Me	OMe

RU 2125053 C1

RU 2125053 C1

Таблица 5 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b	R ^c
C	N	C	C	N	Ph-2-OH	Me	SMe
C	N	C	C	N	Ph-2-OH	Me	Cl
C	N	C	C	N	Ph-2-OH	Me	CF ₃
C	N	C	C	N	Ph-2-OH	Me	Ph
C	N	C	C	N	Ph-3-OH	Me	H
C	N	C	C	N	Ph-3-OH	Me	Me
C	N	C	C	N	Ph-3-OH	Me	Et
C	N	C	C	N	Ph-3-OH	Me	n-Hex
C	N	C	C	N	Ph-3-OH	Me	c-Pr
C	N	C	C	N	Ph-3-OH	Me	c-Hex
C	N	C	C	N	Ph-3-OH	Me	OH
C	N	C	C	N	Ph-3-OH	Me	CH ₂ OH
C	N	C	C	N	Ph-3-OH	Me	OMe
C	N	C	C	N	Ph-3-OH	Me	SMe
C	N	C	C	N	Ph-3-OH	Me	Cl
C	N	C	C	N	Ph-3-OH	Me	CF ₃
C	N	C	C	N	Ph-3-OH	Me	Ph
C	N	C	C	N	Ph-4-OH	Me	H
C	N	C	C	N	Ph-4-OH	Me	Me
C	N	C	C	N	Ph-4-OH	Me	Et
C	N	C	C	N	Ph-4-OH	Me	n-Hex
C	N	C	C	N	Ph-4-OH	Me	c-Pr
C	N	C	C	N	Ph-4-OH	Me	c-Hex
C	N	C	C	N	Ph-4-OH	Me	OH
C	N	C	C	N	Ph-4-OH	Me	CH ₂ OH
C	N	C	C	N	Ph-4-OH	Me	OMe
C	N	C	C	N	Ph-4-OH	Me	SMe
C	N	C	C	N	Ph-4-OH	Me	Cl
C	N	C	C	N	Ph-4-OH	Me	CF ₃
C	N	C	C	N	Ph-4-OH	Me	Ph
C	N	C	C	N	Ph-3,4-(OH) ₂	Me	H
C	N	C	C	N	Ph-3,4-(OH) ₂	Me	Me
C	N	C	C	N	Ph-3,4-(OH) ₂	Me	Et
C	N	C	C	N	Ph-3,4-(OH) ₂	Me	n-Hex
C	N	C	C	N	Ph-3,4-(OH) ₂	Me	c-Pr
C	N	C	C	N	Ph-3,4-(OH) ₂	Me	c-Hex
C	N	C	C	N	Ph-3,4-(OH) ₂	Me	OH
C	N	C	C	N	Ph-3,4-(OH) ₂	Me	CH ₂ OH
C	N	C	C	N	Ph-3,4-(OH) ₂	Me	OMe
C	N	C	C	N	Ph-3,4-(OH) ₂	Me	SMe
C	N	C	C	N	Ph-3,4-(OH) ₂	Me	Cl
C	N	C	C	N	Ph-3,4-(OH) ₂	Me	CF ₃
C	N	C	C	N	Ph-3,4-(OH) ₂	Me	Ph
C	N	C	C	N	Ph-3-SMe	Me	H

RU 2125053 C1

RU 2125053 C1

Таблица 5 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b	R ^c
C	N	C	C	N	Ph-3-SMe	Me	Me
C	N	C	C	N	Ph-3-SMe	Me	Et
C	N	C	C	N	Ph-3-SMe	Me	n-Hex
C	N	C	C	N	Ph-3-SMe	Me	c-Pr
C	N	C	C	N	Ph-3-SMe	Me	c-Hex
C	N	C	C	N	Ph-3-SMe	Me	OH
C	N	C	C	N	Ph-3-SMe	Me	CH ₂ OH
C	N	C	C	N	Ph-3-SMe	Me	OMe
C	N	C	C	N	Ph-3-SMe	Me	SMe
C	N	C	C	N	Ph-3-SMe	Me	Cl
C	N	C	C	N	Ph-3-SMe	Me	CF ₃
C	N	C	C	N	Ph-3-SMe	Me	Ph
C	N	C	C	N	Ph-3-CF ₃	Me	H
C	N	C	C	N	Ph-3-CF ₃	Me	Me
C	N	C	C	N	Ph-3-CF ₃	Me	Et
C	N	C	C	N	Ph-3-CF ₃	Me	n-Hex
C	N	C	C	N	Ph-3-CF ₃	Me	c-Pr
C	N	C	C	N	Ph-3-CF ₃	Me	c-Hex
C	N	C	C	N	Ph-3-CF ₃	Me	OH
C	N	C	C	N	Ph-3-CF ₃	Me	CH ₂ OH
C	N	C	C	N	Ph-3-CF ₃	Me	OMe
C	N	C	C	N	Ph-3-CF ₃	Me	SMe
C	N	C	C	N	Ph-3-CF ₃	Me	Cl
C	N	C	C	N	Ph-3-CF ₃	Me	CF ₃
C	N	C	C	N	Ph-3-CF ₃	Me	Ph
C	N	C	C	N	Ph-3-NO ₂	Me	H
C	N	C	C	N	Ph-3-NO ₂	Me	Me
C	N	C	C	N	Ph-3-NO ₂	Me	Et
C	N	C	C	N	Ph-3-NO ₂	Me	n-Hex
C	N	C	C	N	Ph-3-NO ₂	Me	c-Pr
C	N	C	C	N	Ph-3-NO ₂	Me	c-Hex
C	N	C	C	N	Ph-3-NO ₂	Me	OH
C	N	C	C	N	Ph-3-NO ₂	Me	CH ₂ OH
C	N	C	C	N	Ph-3-NO ₂	Me	OMe
C	N	C	C	N	Ph-3-NO ₂	Me	SMe
C	N	C	C	N	Ph-3-NO ₂	Me	Cl
C	N	C	C	N	Ph-3-NO ₂	Me	CF ₃
C	N	C	C	N	Ph-3-NO ₂	Me	Ph
C	N	C	C	N	Ph-3-NO ₂	Me	H
C	N	C	C	N	Ph-4-NMe ₂	Me	Me
C	N	C	C	N	Ph-4-NMe ₂	Me	Et
C	N	C	C	N	Ph-4-NMe ₂	Me	n-Hex
C	N	C	C	N	Ph-4-NMe ₂	Me	c-Pr
C	N	C	C	N	Ph-4-NMe ₂	Me	c-Hex

RU 2125053 C1

RU 2125053 C1

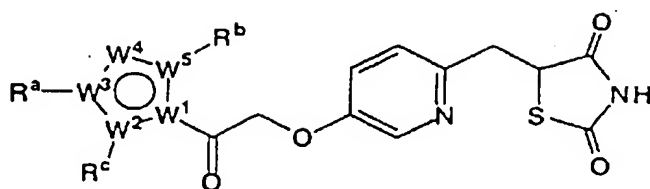
Таблица 5 (продолжение)

W^1	W^2	W^3	W^4	W^5	R^a	R^b	R^c
C	N	C	C	N	Ph-4-NMe ₂	Me	OH
C	N	C	C	N	Ph-4-NMe ₂	Me	CH ₂ OH
C	N	C	C	N	Ph-4-NMe ₂	Me	OMe
C	N	C	C	N	Ph-4-NMe ₂	Me	SMe
C	N	C	C	N	Ph-4-NMe ₂	Me	Cl
C	N	C	C	N	Ph-4-NMe ₂	Me	CF ₃
C	N	C	C	N	Ph-4-NMe ₂	Me	Ph
C	N	C	C	N	Ph	Me	H
C	N	C	C	N	Ph	Me	H
C	O	C	C	C	Ph	Me	H
C	S	C	C	C	Ph	Me	H
C	N	N	C	C	Ph	Me	H

RU 2125053 C1

RU 2125053 C1

Таблица 6

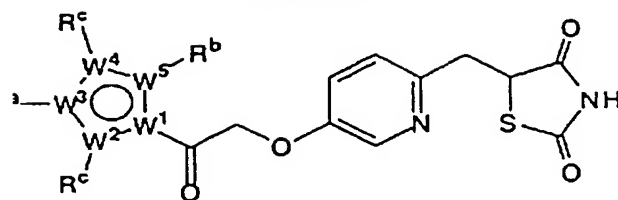


W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b	R ^c
C	C	C	NH	C	Ph	Me	H
C	C	C	NH	C	Br	H	H
C	C	C	NH	C	Br	H	Me
C	C	C	NH	C	Br	Me	Me
C	N	C	C	C	Ph	Me	H
C	N	C	C	C	Ph	Me	Me
C	N	C	C	C	Ph	H	Me
C	N	C	C	C	Ph	H	H
C	N	C	C	C	H	H	Me
C	N	C	C	C	H	H	H
C	N	C	C	C	H	Me	Me
C	N	C	C	C	H	Me	H
C	C	C	O	C	Ph	Me	H
C	C	C	O	C	Me	Me	H
C	C	C	O	C	H	Me	Me
C	C	C	S	C	Ph	Me	H
C	C	C	S	C	Me	Me	H
C	C	C	S	C	H	H	H
C	C	N	N	C	Ph	Me	H
C	C	N	N	C	Ph	H	Me
C	C	N	N	C	Ph	H	H
C	C	C	N	N	Ph	Me	H
C	N	C	N	C	Ph	Me	H
C	N	C	N	C	Ph	Me	Me
C	N	C	N	C	Ph	H	Me
C	N	C	N	C	Ph	H	H

RU 2125053 C1

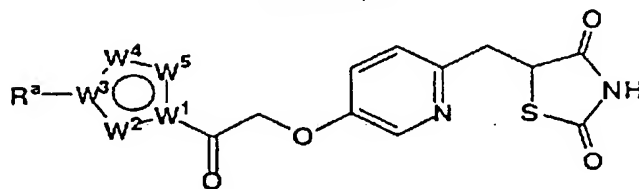
RU 2125053 C1

Таблица 7



W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a	R ^b	R ^c
N	C	C	C	C	Ph	Me	H
C	C	C	C	N	Ph	Me	H
C	C	N	C	C	Ph	Me	H
N	C	C	C	N	Ph	Me	H
N	N	N	C	C	Ph	Me	H
N	N	C	C	N	Ph	Me	H
N	C	C	N	N	Ph	Me	H
C	C	N	N	N	Ph	Me	H

Таблица 8

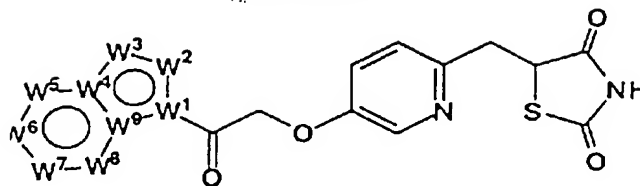


W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	R ^a
C	C	C	N	O	Ph
C	C	C	N	O	Ph-2,4-Cl ₂
C	C	C	N	O	Ph-3,4-Cl ₂
C	C	C	N	O	Ph-2,4-Me ₂
C	C	N	C	N	Ph
C	S	C	C	N	H
C	S	C	C	N	Ph
C	N	C	C	S	Ph

RU 2125053 C1

RU 2125053 C1

Таблица 9



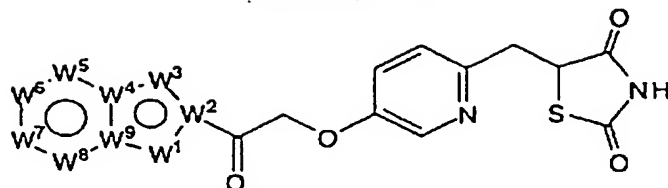
W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	W ⁶	W ⁷	W ⁸	W ⁹
CH	CH	CH	C	CH	CH	CH	CH	C
C	CMe	NH	C	CH	CH	CH	CH	C
C	CMe	NMe	C	CH	CH	CH	CH	C
C	CH	NH	C	CH	CH	CH	CH	C
C	CH	S	C	CH	CH	CH	CH	C
N	CH	N	C	CH	CH	CH	CH	C
C	CH	O	C	CH	CH	CH	CH	C
C	CH	CH	C	CH	CH	CH	CH	N
C	N	NH	C	CH	CH	CH	CH	C
C	N	NMe	C	CH	CH	CH	CH	C
N	N	N	C	CH	CH	CH	CH	C
N	CH	N	C	N	CH	N	CH	C
C	CH	N	N	CH	CH	CH	N	C
C	CH	N	N	CH	CH	N	N	C
C	CMe	S	C	N	CCF ₃	N	-*	N
C	CMe	S	C	N	CMe	N	-	N
C	CH	S	C	N	CH	N	-	N

*; covalent bond ковалентная связь

RU 2125053 C1

RU 2125053 C1

Таблица 10



W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	W ⁶	W ⁷	W ⁸	W ⁹
CH ₂	C	CMe	C	CH	CH	CH	CH	C
CH ₂	C	CH	C	CH	CH	CH	CH	C
NMe	C	CH	C	CH	CH	CH	CH	C
NH	C	CH	C	CH	CH	CH	CH	C
NMe	C	CMe	C	CH	CH	CH	CH	C
NH	C	CMe	C	CH	CH	CH	CH	C
NH	C	CH	C	CH	CBr	CH	CH	C
NH	C	CH	C	CH	CPh	CH	CH	C
NMe	C	CH	C	CH	CMe	CH	CH	C
NMe	C	CH	C	CH	CBr	CH	CH	C
NMe	C	CH	C	CH	CPh	CH	CH	C
S	C	CMe	C	CH	CCl	CH	CH	C
S	C	CMe	C	CH	CH	CH	CH	C
S	C	CH	C	CH	CH	CH	CH	C
S	C	CH	C	CH	CPh	CH	CH	C
S	C	CMe	C	CH	CPh	CH	CH	C
O	C	CH	C	CH	CH	CH	COMe	C
O	C	CMe	C	CH	CH	CH	CH	C
O	C	CH	C	CH	CH	CH	CH	C
O	C	CH	C	CH	CPh	CH	CH	C
O	C	CMe	C	CH	CPh	CH	CH	C
NH	C	N	C	CH	CH	CH	CH	C
NMe	C	N	C	CH	CH	CH	CH	C
NH	C	N	C	CH	CMe	CMe	CH	C
NMe	C	N	C	CH	CMe	CMe	CH	C
NH	C	N	C	CH	CPh	CH	CH	C
NMe	C	N	C	CH	CPh	CH	CH	C
NMe	C	N	C	CH	CH	CPh	CH	C
N	C	O	C	CH	CH	CH	CH	C
N	C	O	C	CH	CPh	CH	CH	C
N	C	O	C	CH	CH	CPh	CH	C
N	C	O	C	CH	CMe	CH	CH	C
N	C	O	C	CH	CH	CMe	CH	C
N	C	S	C	CH	CH	CH	CH	C

RU 2125053 C1

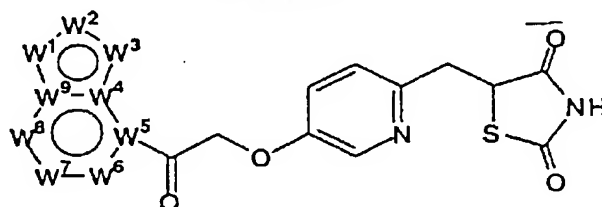
RU 2125053 C1

Таблица 10 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	W ⁶	W ⁷	W ⁸	W ⁹
N	C	S	C	CH	CPh	CH	CH	C
N	C	S	C	CH	CH	CPh	CH	C
N	C	S	C	CH	CMe	CH	CH	C
N	C	S	C	CH	CH	CMe	CH	C
CH	C	CH	C	CH	CH	CH	CH	N
NH	C	N	C	N	CH	N	CH	C
NMe	C	N	C	N	CH	N	CH	C
N	C	CH	C	N	CH	CH	CH	N
N	C	CH	C	N	N	CH	CH	N
S	C	CMe	N	N	CCF ₃	N	-*	C
S	C	CMe	N	N	CMe	N	-	C
S	C	CH	N	N	CH	N	-	C

*; covalent bond ковалентная связь

Таблица 11

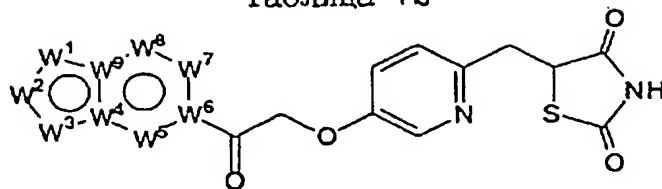


W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	W ⁶	W ⁷	W ⁸	W ⁹
CH ₂	CH	CH	C	C	CH	CH	CH	C
CH	CH	CH ₂	C	C	CH	CH	CH	C
NMe	CH	CH	C	C	CH	CH	CH	C
CH	CH	NMe	C	C	CH	CH	CH	C
S	CH	CH	C	C	CH	CH	CH	C
CH	CH	S	C	C	CH	CH	CH	C
O	CH	CH	C	C	CH	CH	CH	C
CH	CH	O	C	C	CH	CH	CH	C
NH	C	N	C	C	CH	CH	CH	C
NMe	C	N	C	C	CH	CH	CH	C
N	C	NMe	C	C	CH	CH	CH	C
N	C	O	C	C	CH	CH	CH	C
O	C	N	C	C	CH	CH	CH	C
N	C	S	C	C	CH	CH	CH	C
S	C	N	C	C	CH	CH	CH	C
CH	CH	CH	C	C	CH	CH	CH	N
CH	CH	CH	N	C	CH	CH	CH	C
NH	CH	N	C	C	N	CH	N	C
CH	CH	N	N	C	CH	CH	N	C
CH	CH	N	N	C	CH	N	N	C

RU 2 1 2 5 0 5 3 C 1

RU 2 1 2 5 0 5 3 C 1

Таблица 12

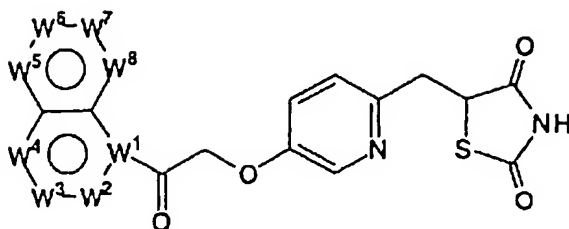


W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	W ⁶	W ⁷	W ⁸	W ⁹
CH ₂	CH	CH	C	CH	C	CH	CH	C
CH	CH	CH ₂	C	CH	C	CH	CH	C
NMe	CH	CH	C	CH	C	CH	CH	C
CH	CH	NMe	C	CH	C	CH	CH	C
S	CH	CH	C	CH	C	CH	CH	C
CH	CH	S	C	CH	C	CH	CH	C
S	CH ₂	CH ₂	C	CH	C	CH	CH	C
CH ₂	CH ₂	S	C	CH	C	CH	CH	C
O	CH	CH	C	CH	C	CH	CH	C
CH	CH	O	C	CH	C	CH	CH	C
O	CH ₂	CH ₂	C	CH	C	CH	CH	C
CH ₂	CH ₂	O	C	CH	C	CH	CH	C
NH	C	N	C	CH	C	CH	CH	C
NMe	C	N	C	CH	C	CH	CH	C
N	C	NMe	C	CH	C	CH	CH	C
N	C	O	C	CH	C	CH	CH	C
O	C	N	C	CH	C	CH	CH	C
N	C	S	C	CH	C	CH	CH	C
S	C	N	C	CH	C	CH	CH	C
CH	CH	CH	C	CH	C	CH	CH	N
CH	CH	CH	N	CH	C	CH	CH	C
NH	CH	N	C	N	C	N	CH	C
CH	CH	N	N	CH	C	CH	N	C
CH	CMe	N	N	CMe	C	CH	N	C
CH	CH	N	N	CH	C	N	N	C
CH	CMe	N	N	CMe	C	N	N	C
CH	CPh	N	N	CMe	C	CH	N	C
CH	CPh	N	N	CMe	C	N	N	C

RU 2125053 C1

RU 2125053 C1

Таблица 13



W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	W ⁶	W ⁷	W ⁸
C	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH
C	CH	CH	CH	CH	CH	CH	N
C	CH	CH	CH	N	CH	CH	CH
C	CH	CH	N	CH	CH	CH	CH
C	CH	CH	CH	CH	CH	N	CH
C	CH	CH	CH	CH	N	CH	CH
C	CH	N	CH	CH	CH	CH	CH
C	N	CH	CH	CH	CH	CH	CH
C	CH	CH	CH	O	CH ₂	CH ₂	O
C	CH	CH	CH	O	CH	CH	O
C	N	N	CH	CH	CH	CH	CH
C	CH	CH	CH	CH	N	N	CH
C	CH	CH	N	N	CH	CH	CH
C	CH	CH	CH	N	CH	CH	N
C	CH	CH	CH	N	CH	N	CH
C	CH	CH	CH	CH	CH	N	N
C	CH	CH	CH	N	N	CH	CH
C	N	CH	N	N	CH	CH	N
N	CH	CH	S	CH	CH	CH	CH
C	CH	CH	CH	S	CH	CH	NH
C	CH	CH	CH	S	CH	CH	NMe
C	CH	CH	CH	NH	CH	CH	S
C	CH	CH	CH	NMe	CH	CH	S
N	CO	CH	CH	CH	CH	CH	CH
N	CH	CH	CO	CH	CH	CH	CH
C	CH	CH	CH	NH	CO	CH	CH
C	CH	CH	CH	NMe	CO	CH	CH
C	CH	CH	CH	CH	CH	CO	NH
C	CH	CH	CH	CH	CH	CO	NMe
C	CH	CH	CH	NH	CH	CH	CO
C	CH	CH	CH	NMe	CH	CH	CO
C	CH	CH	CH	CO	CH	CH	NH
C	CH	CH	CH	CO	CH	CH	NMe
C	CH	NH	CO	CH	CH	CH	CH

RU 2125053 C1

RU 2125053 C1

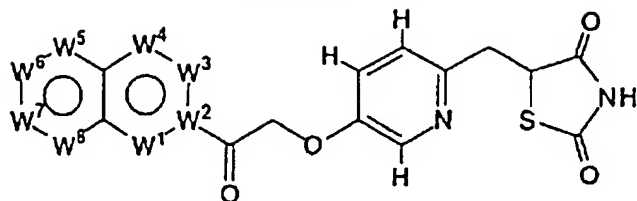
Таблица 13 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	W ⁶	W ⁷	W ⁸
C	CH	NMe	CO	CH	CH	CH	CH
C	CH	CH	CH	CO	NH	CH	CH
C	CH	CH	CH	CO	NMe	CH	CH
C	CH	CH	CH	CH	CH	NH	CO
C	CH	CH	CH	CH	CH	NMe	CO
C	CO	NH	CH	CH	CH	CH	CH
C	CO	NMe	CH	CH	CH	CH	CH
C	NH	CO	CH	CH	CH	CH	CH
C	NMe	CO	CH	CH	CH	CH	CH
C	CH	CH	CH	CH	NH	CO	CH
C	CH	CH	CH	CH	NMe	CO	CH
C	CH	CH	CH	CH	CO	NH	CH
C	CH	CH	CH	CH	CO	NMe	CH
C	N	NH	CO	CH	CH	CH	CH
C	N	NMe	CO	CH	CH	CH	CH
C	CH	CH	CH	CH	N	NH	CO
C	CH	CH	CH	CH	N	NMe	CO
C	CH	CH	CH	CO	NH	N	CH
C	CH	CH	CH	CO	NMe	N	CH

RU 2125053 C1

RU 2125053 C1

Таблица 14



W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	W ⁶	W ⁷	W ⁸
CH	C	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CH	C	CH	CH	CH	CH	CH	N
CH	C	CH	CH	N	CH	CH	CH
N	C	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CH	C	CH	N	CH	CH	CH	CH
CH	C	CH	CH	CH	CH	N	CH
CH	C	CH	CH	CH	N	CH	CH
CH	C	N	CH	CH	CH	CH	CH
CH	C	CH	CH	O	CH ₂	CH ₂	O
CH	C	CH	CH	O	CH	CH	O
CH	C	CH	CH	CH	N	N	CH
CH	C	CH	N	N	CH	CH	CH
N	C	CH	CH	CH	CH	CH	N
N	C	CH	N	CH	CH	CH	CH
CH	C	CH	CH	N	CH	CH	N
N	C	N	CH	CH	CH	CH	CH
CH	C	CH	CH	CH	N	CH	N
CH	C	CH	CH	N	CH	N	CH
CH	C	N	N	CH	CH	CH	CH
CH	C	CH	CH	CH	CH	N	N
CH	C	CH	CH	N	N	CH	CH
N	C	N	CH	N	CH	CH	N
N	C	CH	N	CH	N	CH	N
N	C	CH	N	N	CH	N	CH
S	C	CH	NH	CH	CH	CH	CH
S	C	CH	NMe	CH	CH	CH	CH
NH	C	CH	S	CH	CH	CH	CH
NMe	C	CH	S	CH	CH	CH	CH
CH	C	CH	CH	NH	CH	CH	S
CH	C	CH	CH	NMe	CH	CH	S
CH	C	CH	CH	S	CH	CH	NH
CH	C	CH	CH	S	CH	CH	NMe
S	C	CMe	NH	CH	CH	CH	CH
S	C	CMe	NMe	CH	CH	CH	CH
CH	C	CO	NH	CH	CH	CH	CH

RU 2 1 2 5 0 5 3 C 1

RU 2 1 2 5 0 5 3 C 1

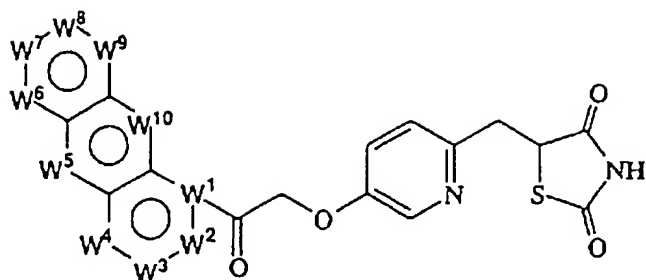
RU 2125053 C1

Таблица 14 (продолжение)

W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	W ⁶	W ⁷	W ⁸
CH	C	CO	NMe	CH	CH	CH	CH
CH	C	CH	CH	NH	CO	CH	CH
CH	C	CH	CH	NMe	CO	CH	CH
CH	C	CH	CH	CH	CH	CO	NH
CH	C	CH	CH	CH	CH	CO	NMe
NH	C	CH	CO	CH	CH	CH	CH
NMe	C	CH	CO	CH	CH	CH	CH
CO	C	CH	NH	CH	CH	CH	CH
CO	C	CH	NMe	CH	CH	CH	CH
CO	N	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CH	C	NH	CO	CH	CH	CH	CH
CH	C	NMe	CO	CH	CH	CH	CH
CH	C	CH	CH	CO	NH	CH	CH
CH	C	CH	CH	CO	NMe	CH	CH
CH	C	CH	CH	CH	CH	NH	CO
CH	C	CH	CH	CH	CH	NMe	CO
CH	N	CO	CH	CH	CH	CH	CH
CH	C	CH	CH	CH	CO	NH	CH
CH	C	CH	CH	CH	CO	NMe	CH
CH	C	CH	CH	CH	NH	CO	CH
CH	C	CH	CH	CH	NMe	CO	CH
CO	N	N	CH	CH	CH	CH	CH
CH	C	CH	CH	CH	N	NH	CO
CH	C	CH	CH	CH	N	NMe	CO
CH	C	CH	CH	CO	NH	N	CH
CH	C	CH	CH	CO	NMe	N	CH

RU 2125053 C1

Таблица 15

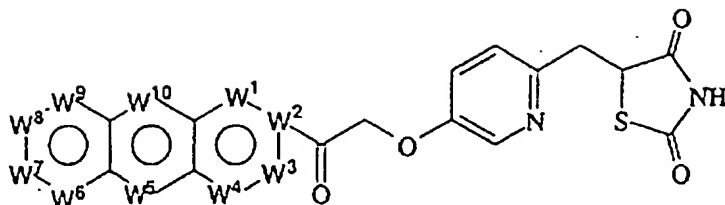


W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	W ⁶	W ⁷	W ⁸	W ⁹	W ¹⁰
C	CH	CH	CH	O	CH	CH	CH	CH	CH ₂
C	CH	CH	CH	CH ₂	CH	CH	CH	CH	O
C	CH	CH	CH	O	CH	CH	CH	CH	S
C	CH	CH	CH	S	CH	CH	CH	CH	O
C	CH	CH	CH	S	CH	CH	CH	CH	S
C	CH	CH	CH	N	CH	CH	CH	CH	CH
C	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH	N
C	CH	CH	CH	N	CH	CH	CH	CH	N
C	CH	CH	CH	S	CH	CH	CH	CH	NH
C	CH	CH	CH	S	CH	CH	CH	CH	NMe
C	CH	CH	CH	NH	CH	CH	CH	CH	S
C	CH	CH	CH	NMe	CH	CH	CH	CH	S
C	CH	CH	CH	O	CH	CH	CH	CH	NH
C	CH	CH	CH	NH	CH	CH	CH	CH	O
C	CH	CH	N	O	CH	CH	CH	CH	CH ₂
C	CH	CH	CH	O	N	CH	CH	CH	CH ₂
C	CH	CH	CH	CH ₂	CH	CH	CH	N	O
C	CH	CH	N	O	CH	CH	CH	CH	CO
C	CH	CH	CH	O	N	CH	CH	CH	CO
C	CH	CH	CH	CO	CH	CH	CH	N	O
C	CH	CH	CH	-	CH	CH	CH	CH	CH ₂
C	CH	CH	CH	CH ₂	CH	CH	CH	CH	-
C	CH	CH	CH	-	CH	CH	CH	CH	NH
C	CH	CH	CH	-	CH	CH	CH	CH	NMe
C	CH	CH	CH	NH	CH	CH	CH	CH	-
C	CH	CH	CH	NMe	CH	CH	CH	CH	-

RU 2125053 C1

RU 2125053 C1

Таблица 16



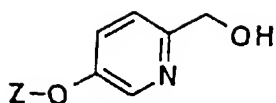
W ¹	W ²	W ³	W ⁴	W ⁵	W ⁶	W ⁷	W ⁸	W ⁹	W ¹⁰
CH	C	CH	CH	O	CH	CH	CH	CH	CH ₂
CH	C	CH	CH	CH ₂	CH	CH	CH	CH	O
CH	C	CH	CH	O	CH	CH	CH	CH	S
CH	C	CH	CH	S	CH	CH	CH	CH	O
CH	C	CH	CH	S	CH	CH	CH	CH	S
CH	C	CH	CH	N	CH	CH	CH	CH	CH
CH	C	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH	N
CH	C	CH	CH	N	CH	CH	CH	CH	N
CH	C	CH	CH	S	CH	CH	CH	CH	NH
CH	C	CH	CH	S	CH	CH	CH	CH	NMe
CH	C	CH	CH	NH	CH	CH	CH	CH	S
CH	C	CH	CH	NMe	CH	CH	CH	CH	S
CH	C	CH	CH	O	CH	CH	CH	CH	NH
CH	C	CH	CH	NH	CH	CH	CH	CH	O
CH	C	CH	N	O	CH	CH	CH	CH	CH ₂
N	C	CH	CH	CH ₂	CH	CH	CH	CH	O
CH	C	CH	CH	O	N	CH	CH	CH	CH ₂
CH	C	CH	CH	CH ₂	CH	CH	CH	N	O
CH	C	CH	N	O	CH	CH	CH	CH	CO
N	C	CH	CH	CO	CH	CH	CH	CH	O
CH	C	CH	CH	O	N	CH	CH	CH	CO
CH	C	CH	CH	CO	CH	CH	CH	N	O
CH	C	CH	CH	-*	CH	CH	CH	CH	CH ₂
CH	C	CH	CH	CH ₂	CH	CH	CH	CH	-
CH	C	CH	CH	-	CH	CH	CH	CH	NH
CH	C	CH	CH	-	CH	CH	CH	CH	NMe
CH	C	CH	CH	NH	CH	CH	CH	CH	-
CH	C	CH	CH	NMe	CH	CH	CH	CH	-
CH	C	CMe	N	O	CH	CH	CH	CH	CO
CH	C	CMe	N	O	CH	CH	CMe	CH	CO

*; covalent bond ковалентная связь

RU 2125053 C1

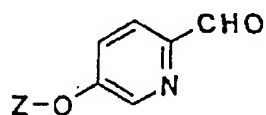
RU 2125053 C1

Таблица к стадии 1 примера 1

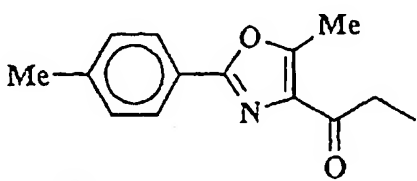
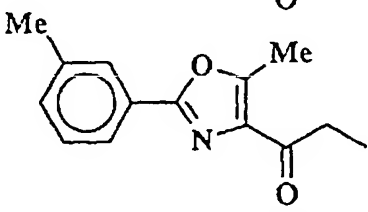
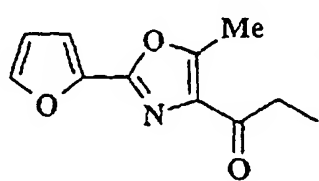
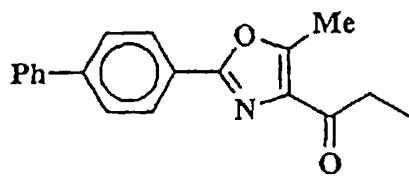
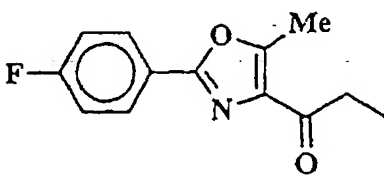
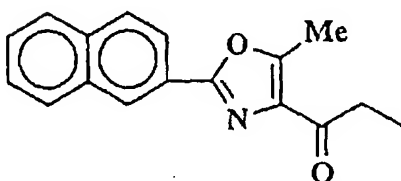
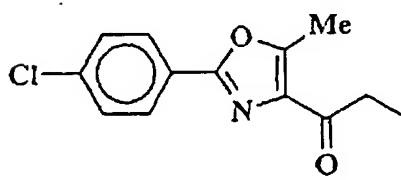
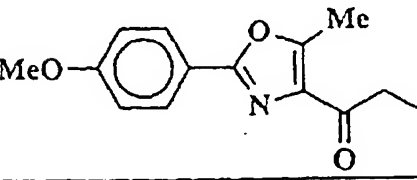


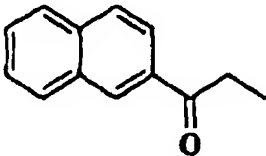
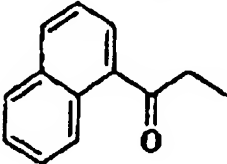
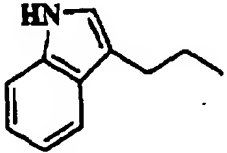
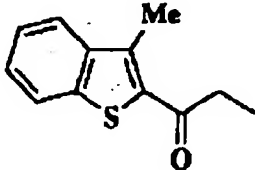
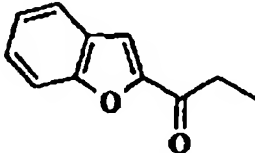
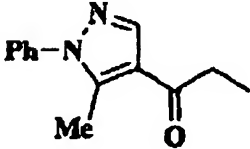
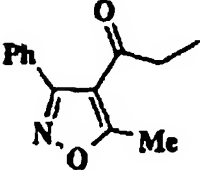
№ соединения	Z	Свойства	Т.пл. (°C) М.-с. m/e
Ш-2	MeOCH ₂	бледно-коричневое масло	170 (M+H) ⁺ FAB
Ш-3	PhCH ₂	коричневое масло	
Ш-4	PhCO	бледно-коричневый порошок	
Ш-5	Me ₃ Si	бледно-коричневое масло	

Таблица к стадии 2 примера 1

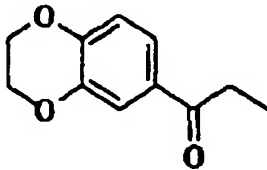
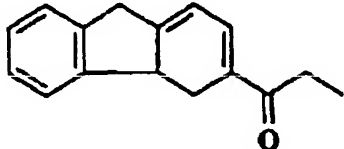
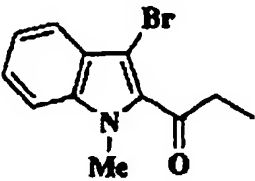

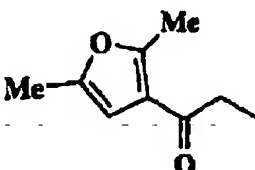
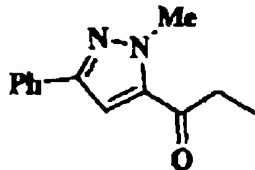
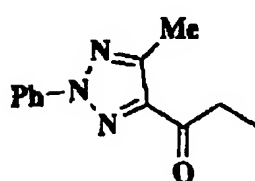


№ соедин.	Z	Свойства	Т.пл. (°C) М.-с. (m/e)
П-2	MeOCH ₂	коричневое масло	168 (M+H) ⁺ FAB
П-3	PhCH ₂	бледно-желтый воск	22-23
П-4	PhCO	бледно-коричневый порошок	85-87
П-5	Me ₃ Si	коричневое масло	

№ соединения	Z	свойства	M. - C.
II-6		бесцветный воск	337(M ⁺ +1)
II-7		бледно - коричневый порошок	337(M ⁺ +1)
II-8		бледно - коричневый порошок	311(M ⁺ -1)
II-9		бледно - коричневый порошок	398(M ⁺)
II-10		бледно - коричневый порошок	339(M ⁺)
II-11		бледно - коричневый порошок	372(M ⁺)
II-12		бледно - коричневый порошок	357(M ⁺ +1)
II-13		бледно - коричневый порошок	351(M ⁺ -1)

№ соединения	Z	свойства, точка плавления (°C)	MS(m/e)
II-14		бледно-желтые кристаллы 127-129	292(M+H) ⁺ FAB
II-15		бесцветные кристаллы 137-138	292(M+H) ⁺ FAB
II-16		бесцветные кристаллы 120-122	267(M+H) ⁺ FAB
II-17		бесцветные кристаллы 136-138	312(M+H) ⁺ FAB
II-18		бесцветные кристаллы 134-136	282(M+H) ⁺ FAB
II-19		бесцветные кристаллы 138-140	322(M+H) ⁺ FAB
II-20		бледно-желтое масло	

RU 2125053 C1

№ соединения	Z	свойства, точка плавления (°C)	MS(m/e)
II-21		бесцветные кристаллы 173-175	300(M+H) ⁺ FAB
II-22		бледно-желтые кристаллы 160-163	330(M+H) ⁺ FAB
II-23		бледно-желтые кристаллы 140-143	373(M+H) ⁺ FAB
II-24		бесцветное масло	254(M+H) ⁺ FAB
II-25		бледно-желтое твердое вещество	259(M) ⁺ EI
II-26		бледно-желтое твердое вещество	321(M) ⁺ EI
II-27		светло-коричневое твердое вещество	322(M) ⁺ EI

RU 2125053 C1

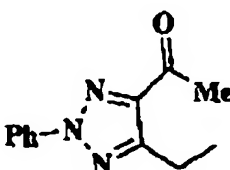
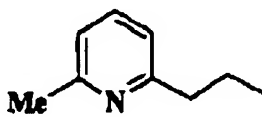
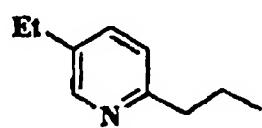
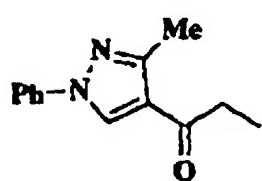
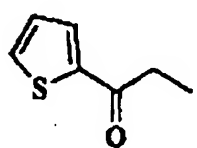
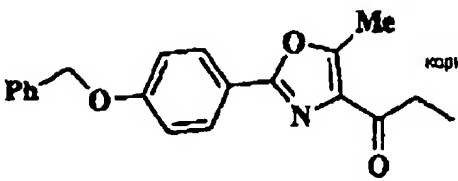
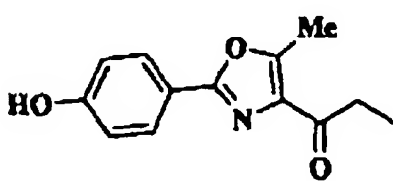
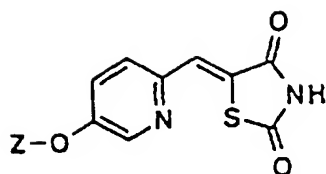
№ соединения	Z	свойства, точка плавления (°C)	MS(m/e)
II-28		коричневое твердое вещество	323(M+H) ⁺ FAB
II-29		блочно-белое масло	242(M) ⁺ EI
II-30		белое аморфное вещество	256(M) ⁺ EI
II-31		бесцветное твердое вещество 153-156	321(M) ⁺ EI
II-32		оранжевое твердое вещество	247(M) ⁺ EI
II-33		коричневый порошок 154-155	
II-34		желтый порошок 201-203	

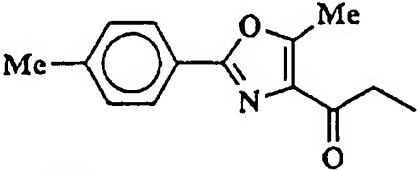
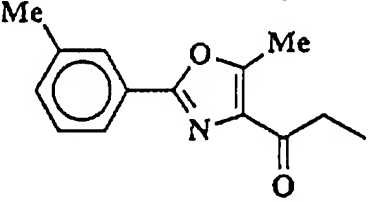
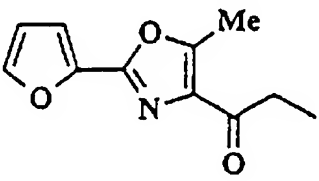
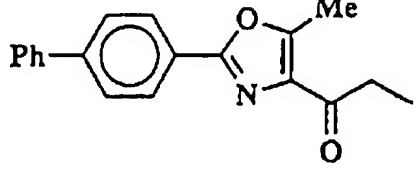
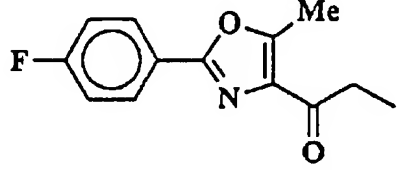
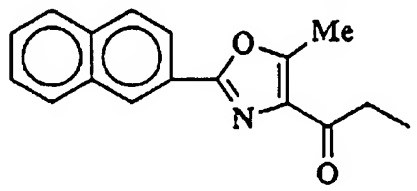
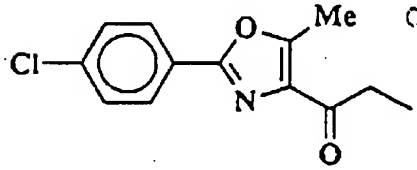
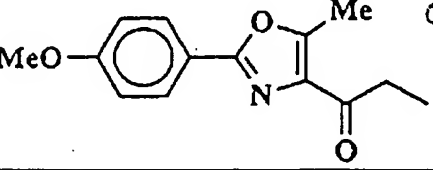
Таблица к стадии 3 примера 1



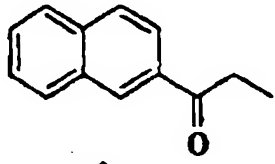
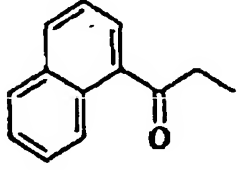
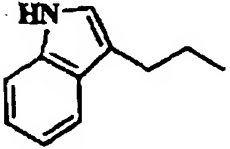
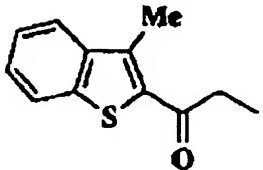
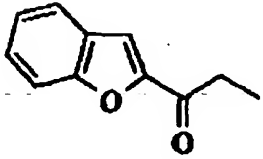
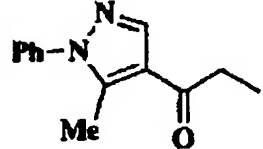
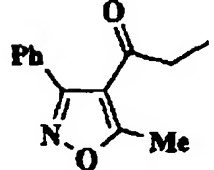
№	Z:	Свойства :	Т.пл. (°C) :	м.-с. (m/e)
соединен.:				
I-1a-2	MeOCH ₂	бледно-коричневый порошок	179,5-196	267 (M+H) ⁺ FAB
I-1a-3	PhCH ₂	бледно-коричневый порошок	207,5-209,5	313 (M+H) ⁺ FAB
I-1a-4	PhCO	коричневое масло		
I-1a-5	Me ₃ Si	коричневое масло		

RU 2125053 C1

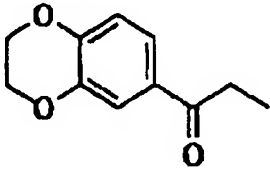
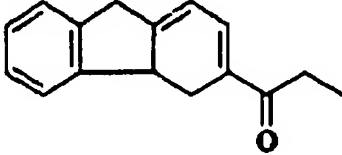
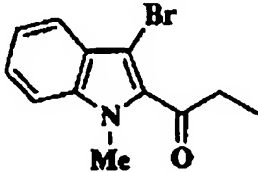

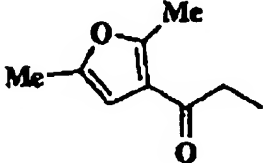
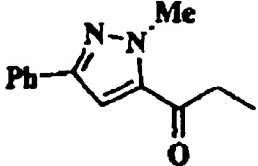
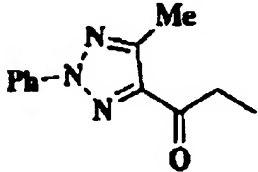
RU 2125053 C1

№ соедин.	Z	свойства т.пл. (°C)	М.-с. MS(m/e)
I-1a-6		белый порошок	436(M ⁺ +1)
I-1a-7		белый порошок	436(M ⁺ +1)
I-1a-8		коричневый порошок	412(M ⁺ +1)
I-1a-9		зеленовато-коричневый порошок	497(M ⁺)
I-1a-10		светло-серый порошок	440(M ⁺ +1)
I-1a-11		светло-серый порошок	471(M ⁺)
I-1a-12		бледно-коричневый порошок 207-215	455, 457(M ⁺)
I-1a-13		бледно-коричневый порошок 250- (разл.)	451(M ⁺)

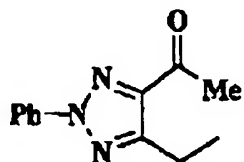
RU 2125053 C1

№ соединения	Z	свойства, точка плавления (°C)	MS(m/e)
I-1a-14		коричневый порошок >209 (разл.)	390(M ⁺) FD
I-1a-15		белый порошок 234-236	391(M+H) ⁺ FAB
I-1a-16		бесцветные кристаллы 94-98	366(M+H) ⁺ FAB
I-1a-17		бледно-желтые иллы 287-289 (разл.)	410(M ⁺) FD
I-1a-18		желто-коричневый порошок >174 (разл.)	
I-1a-19		бледно-желтый порошок 249-251	421(M+H) ⁺ FAB
I-1a-20		бесцветный порошок 205-208	422(M+H) ⁺ FAB

RU 2125053 C1

№ соединения	Z	свойства, точка плавления (°C)	MS(m/e)
I-1a-21		светло-коричневый порошок >230 (разл.)	
I-1a-22		бледно-желтый порошок 268-272 (разл.)	428(M ⁺) FD
I-1a-23		бледно-желтый порошок 230-238 (разл.)	471(M ⁺) FD
I-1a-24		бесцветные кристаллы 124-128	353(M+H) ⁺ FAB
I-1a-25		бледно-желтый порошок 238-240 (разл.)	359(M+H) ⁺ FAB
I-1a-26		бледно-желтый порошок 244-246 (разл.)	421(M+H) ⁺ FAB
I-1a-27		бесцветный порошок 245-249 (разл.)	422(M+H) ⁺ FAB

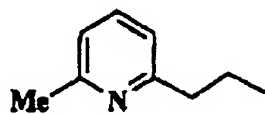
I-1a-28



светло-коричневое твердое
103-110(разл.) вещество

421(M)⁺
EI

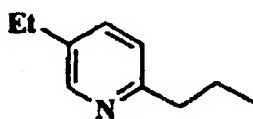
I-1a-29



бесцветное твердое вещество
181-183(разл.)

341(M)⁺
EI

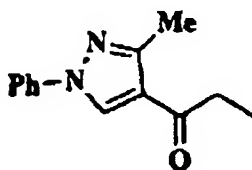
I-1a-30



бесцветное твердое вещество
188-190(разл.)

355(M)⁺
EI

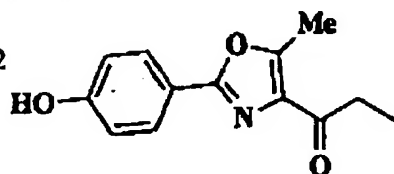
I-1a-31



бледно-желтый порошок
257-259

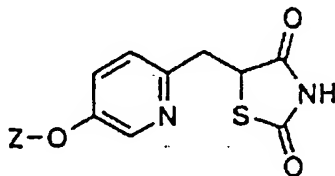
420(M)⁺
EI

I-1a-32

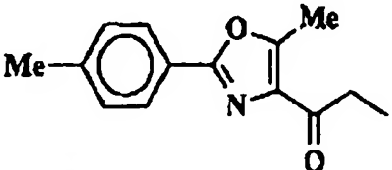
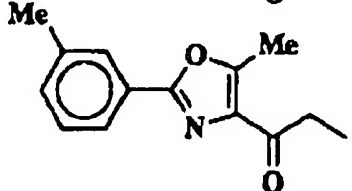
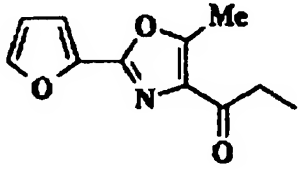
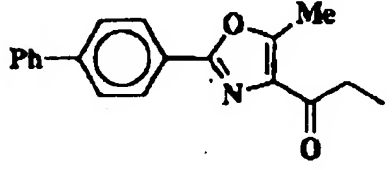
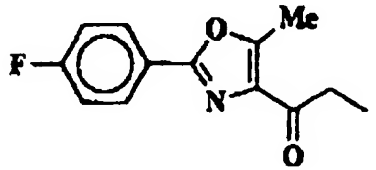
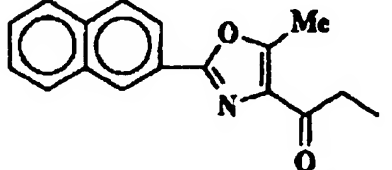
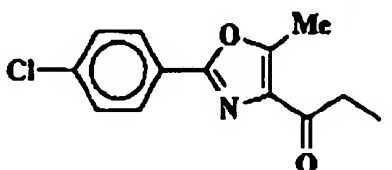
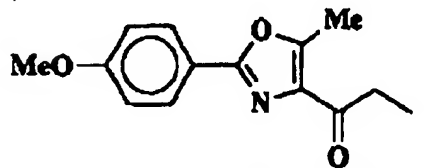


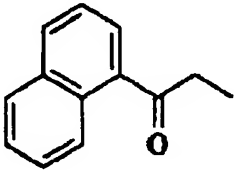
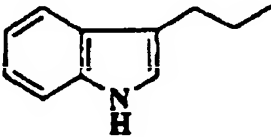
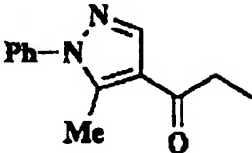
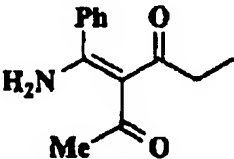
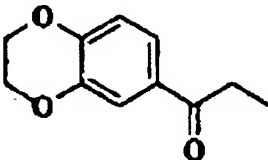
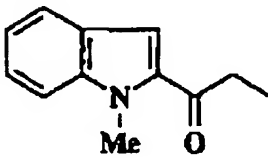

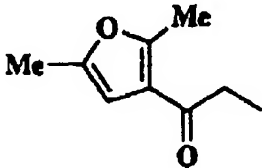
желтый порошок
270(разл.)

Таблица к примеру 2



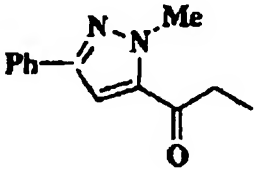
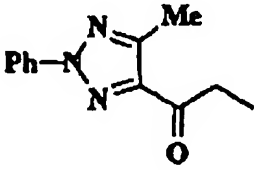
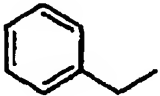
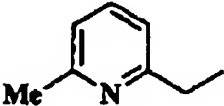
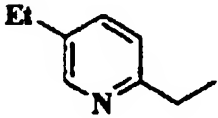
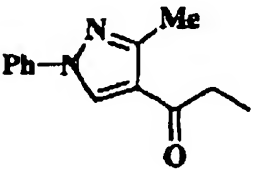
№ соедин.:	Z:	Свойства:	Т.пл. (°C)	М.-с. (m/e)
I-2a-2	MeOCH ₂	бледно-желтое масло		269 (M+H) ⁺ FAB

№ соединения	Z	свойства, точка плавления (°C)	MS(m/e)
I-2a-4		бледно-желтый порошок 181-185	438(M ⁺ +1) FAB
I-2a-5		бесцветный воск	437(M ⁺ +1)
I-2a-6		бледно-желтый порошок 175-178	
I-2a-7		бледно-желтый порошок 154-156	500(M ⁺ +H) FAB
I-2a-8		бесцветное твердое вещество 175-178	442(M ⁺ +H) FAB
I-2a-9		бледно-желтый порошок 75-80	
I-2a-10		бледно-желтый порошок 145-152	
I-2a-11		бесцветный порошок 155-162	

№ соединения	Z	свойства, точка плавления (°C)	MS(m/c)
I-2a-12		бесцветный порошок 151-153 (разл.)	393(M+H) ⁺ FAB
I-2a-13		бледно-желтое аморфное вещество	368(M+H) ⁺ FAB
I-2a-14		бесцветные кристаллы 88-90	423(M+H) ⁺ FAB
I-2a-15		бесцветное аморфное вещество	426(M+H) ⁺ FAB
I-2a-16		бледно-желтый порошок 150-155	401(M+H) ⁺ FD
I-2a-17		бледно-желтое аморфное вещество	355(M+H) ⁺ FAB
I-2a-18		бесцветное масло	
I-2a-19		бесцветные кристаллы 147-149	361(M+H) ⁺ FAB

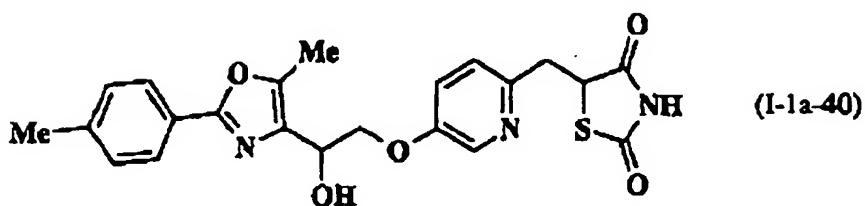
RU 2 1 2 5 0 5 3 C 1

RU 2 1 2 5 0 5 3 C 1

№ соединения	Z	свойства, точка плавления (°C)	MS(m/e)
I-2a-20		бесцветный порошок 87-105(разл.)	423(M+H) ⁺ FAB
I-2a-21		бесцветное твердое вещество 108-110(разл.)	424(M+H) ⁺ FAB
I-2a-22		бесцветные кристаллы 125-128	315(M+H) ⁺ FAB
I-2a-23		блочно-желтое твердое вещество 114-116(разл.)	343(M) ⁺ EI
I-2a-24		бесцветное твердое вещество 154-156(разл.)	358(M+H) ⁺ FAB
I-2a-25		бесцветный порошок 133-136	422(M) ⁺ EI

RU 2 1 2 5 0 5 3 C 1

RU 2 1 2 5 0 5 3 C 1



№ соединения	Z	свойства, точка плавления (°C)	MS(m/e)
I-1a-40		бледно-желтый порошок 231-235	437(M ⁺) FD
I-1a-41		бесцветный порошок 263-265 (разл.)	423(M ⁺) FD
I-1a-42		бесцветный порошок 254-257 (разл.)	442(M+H) ⁺ FAB
I-1a-43		бледно-желтый порошок 179-183	499(M+H) ⁺ FD
I-1a-44		бесцветное твердое вещество 187-188	423(M+H) ⁺ FAB

RU 2 1 2 5 0 5 3 C 1

RU 2 1 2 5 0 5 3 C 1

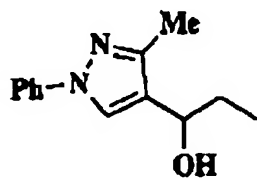
№ соединения

Z

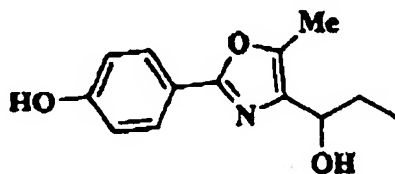
свойства,
точка плавления (°C)

MS(m/e)

I-1a-45

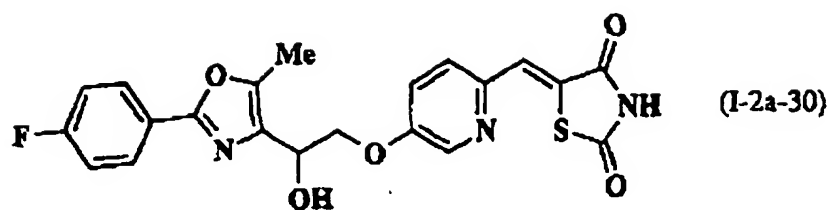
светло-коричневые кристаллы
197-198422(M⁺)
EI

I-1a-46

бледно-желтый порошок
260-261

RU 2125053 C1

RU 2125053 C1



№ соединения	Z	свойства, точка плавления (°C)	MS(m/e)
I-2a-30		бесцветные кристаллы 189-192	444(M+H) ⁺ FAB
I-2a-31		бесцветные кристаллы 134-138	502(M+H) ⁺ FD
I-2a-32		бледно-желтый порошок 181-183	440(M+H) ⁺ FD
I-2a-33		бесцветные кристаллы 87-90 (разл.)	425(M+H) ⁺ FAB
I-2a-34		бесцветное аморфное вещество	425(M+H) ⁺ FAB

RU 2125053 C1

RU 2125053 C1

мъши КК

№ соединения	доза (мг/кг)	% ослабления
I-1a-1	30	48,9
I-2a-1	30	65,1
глибенкламид	30	-3,6
CS-045	30	24,2
CP-86325	30	39,4

мъши ККАу

№ соединения	доза (мг/кг)	% ослабления
I-1a-1	30	48,6
I-1a-43	30	47,3
I-2a-1	30	50,0
I-2a-2	30	39,9
I-2a-5	30	47,7
I-2a-30	30	37,2
I-2a-31	30	52,2
I-2a-32	30	35,4
глибенкламид	30	-2,5
CS-045	30	-3,0
CP-86325	30	39,5

RU 2125053 C1

RU 2125053 C1

Соединения данного изобретения проявляют гипогликемическую активность

Таблица А

Соединение	Доза (мг/кг)	% уменьшения
I-1a-1	20	27,3

Антигликационное действие вычисляют как процент от контрольных данных.

Таблица В

№ соединения:	Концентрация:	0% снижения
I-1a-1	100 мкг/мл (0,24 мМ)	42,3
I-1a-2	100 мкг/мл (0,38 мМ)	24,1
I-1a-3	100 мкг/мл (0,32 мМ)	34,1
CS-045	100 мкг/мл	10,1
CP-86325	100 мкг/мл	10,3
аминогуанидин	(1 мМ)	21,4
аминогуанидин	(10 мМ)	48,9
аминогуанидин	(100 мМ)	80,2

RU 2125053 C1

RU 2125053 C1